

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 642 195**

51 Int. Cl.:

C07D 213/81	(2006.01)	C07D 207/46	(2006.01)
C07D 231/14	(2006.01)	C07D 277/56	(2006.01)
C07D 231/56	(2006.01)	A01N 37/30	(2006.01)
C07D 233/90	(2006.01)	A01N 43/40	(2006.01)
C07D 401/12	(2006.01)	A01N 43/50	(2006.01)
C07D 239/28	(2006.01)		
C07D 241/24	(2006.01)		
C07D 471/04	(2006.01)		
C07C 233/76	(2006.01)		
C07C 235/46	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **16.04.2014 PCT/EP2014/057835**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **23.10.2014 WO14170413**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.04.2014 E 14718404 (8)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.07.2017 EP 2986593**

54 Título: **Compuestos 2-(fenil sustituido)ciclopentan-1,3-diónicos activos como herbicidas y sus derivados**

30 Prioridad:

19.04.2013 GB 201307093
06.06.2013 GB 201310115

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
15.11.2017

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

AVERY, ALARIC JAMES;
TAYLOR, JOHN BENJAMIN;
VINER, RUSSELL COLIN;
WAILES, JEFFERY STEVEN;
CLOUDSDALE, IAN STUART;
ASPINALL, IAN HENRY;
BLACK, JANICE;
BRIGGS, EMMA;
HACHISU, SHUJI;
HARDY, SIMON y
DICKSON, JOHN KENNETH JR

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 642 195 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos 2-(fenil sustituido)ciclopentan-1,3-diónicos activos como herbicidas y sus derivados

La presente invención se refiere a compuestos ciclopentanodiónicos activos como herbicidas novedosos, específicamente compuestos 2-(fenil sustituido)ciclopentan-1,3-diónicos y sus derivados (p. ej., sus derivados del tautómero cetoenólico), a procesos para su preparación, a composiciones herbicidas que comprenden estos compuestos y a su uso para el control de malezas, tales como malezas monocotiledóneas herbáceas, especialmente en cultivos de plantas útiles, o para inhibir el crecimiento vegetal no deseado.

El documento US 4.338.122 (cesionario: Union Carbide Corp.) describe compuestos 2-aril-1,3-ciclopentanodiónicos que exhiben actividad acaricida y herbicida. El documento WO 96/01798 (Bayer AG) y su patente derivada US 5.840.661 describen derivados de 2-arilciclopentan-1,3-diona y su uso como pesticidas y herbicidas. El documento WO 96/03366 (Bayer AG) y su patente derivada US 5.808.135 describen derivados de 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentan-1,3-diona condensados y su uso como pesticidas y herbicidas.

WO 99/43649 A1 (Bayer AG) describe, *inter alia*, cetoenoles cíclicos sustituidos con 4-arilfenilo o sustituidos con 4-heteroarilfenilo, incluidos varios tipos de dionas cíclicas y sus derivados. WO 99/48869 A1 (Bayer AG) describe, *inter alia*, cetoenoles cíclicos sustituidos con 3-arilfenilo o sustituidos con 3-heteroarilfenilo, incluidos varios tipos de dionas cíclicas y sus derivados.

El documento WO 01/17972 A2 (Syngenta Participations AG) describe heterociclos o derivados de ciclopentadiona sustituidos con fenilo (tales como sustituidos con 4-metil-2,6-dietilfenil) adecuados para utilizar como herbicidas. El documento WO 01/74770 (Bayer AG) y su equivalente US 2003/0216260 A1 describen cetoenoles cíclicos sustituidos con C₂-fenilo y su uso como pesticidas y herbicidas.

El documento WO 2009/019005 A2 (Syngenta Limited) describe derivados de ciclopentanodiona bicíclicos condensados y con puentes de oxígeno, específicamente 10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-dionas y sus derivados, que están sustituidos con fenilo sustituido y que tienen actividad herbicida.

El documento WO 2010/000773 A1 (Syngenta Limited) describe 5-(heterociclilalquil)-3-hidroxi-2-fenilciclopent-2-enonas y ciertos derivados de estas como herbicidas.

El documento WO 2010/069834 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited) describe ciclopentan-1,3-dionas, con un sustituyente heteroarilmetil- y un sustituyente fenilo sustituido en las posiciones 4 y 2 del anillo ciclopentano, respectivamente, y sus derivados que contienen grupos protectores; estos compuestos se describen como compuestos con propiedades herbicidas.

El documento WO 2011/007146 A1 (Syngenta Limited) describe ciertos derivados de 2-(fenil sustituido)ciclopentan-1,3-diona con propiedades herbicidas y/o inhibitoras del crecimiento vegetal, en los que en la posición 4 de la ciclopentan-1,3-diona hay un sustituyente A-CHR⁴- en el que A no está sustituido o está sustituido con cicloalquilo C₃-C₇ o A es fenilo opcionalmente sustituido.

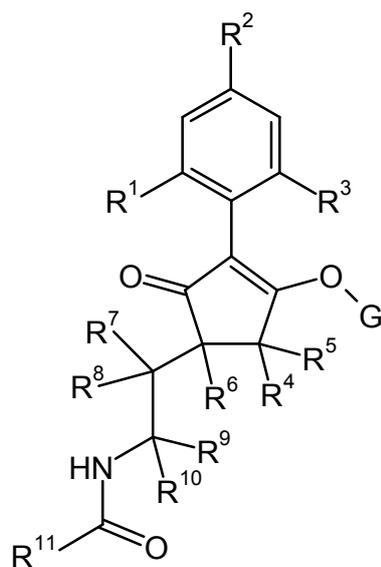
En los documentos WO 2010/089210 A1 y WO 2010/102848 A1 (ambos de Syngenta Limited) se describen otros compuestos ciclopentan-1,3-diónicos sustituidos con fenilo sustituido y que tienen actividad herbicida.

El documento WO 2010/102758 A2 (Bayer CropScience AG) describe cetoenoles cíclicos sustituidos con (haloalquilmetoxi)fenilo como agentes para el control de plagas y/o como herbicidas.

La solicitud de PCT en tramitación junto con la presente PCT/EP2012/074172, presentada el 30 de noviembre de 2012 y publicada el 6 de junio de 2013 como WO 2013/079708 A1 (Syngenta Limited y Syngenta Participations AG) describe compuestos ciclopentan-1,3-diónicos y sus derivados (por ejemplo, derivados condensados y/o bicíclicos espirocíclicos), que están sustituidos en la posición 2 de la ciclopentan-1,3-diona con un fenilo que está a su vez sustituido en la posición 4 con (específicamente) prop-1-inilo o cloroetileno, y los derivados del tautómero cetoenólico de dichas ciclopentanodionas, que tienen actividad herbicida, especialmente en el control de malezas monocotiledóneas herbáceas y/o cuando se utilizan después de la emergencia.

Ahora se han descubierto compuestos 2-(fenil sustituido)ciclopentan-1,3-diónicos y derivados del tautómero cetoenólico de tales ciclopentan-1,3-dionas, que tienen un sustituyente que contiene una amida (R¹¹-C(O)-NH-CR⁹R¹⁰-CR⁷R⁸-) en la posición 4 o 5 de la ciclopentan-1,3-diona, y que tienen actividad herbicida y/o propiedades inhibitoras del crecimiento vegetal, especialmente en el control de malezas monocotiledóneas herbáceas y/o cuando se utilizan después de la emergencia, que están contemplados por la presente invención.

Por lo tanto, en un primer aspecto de la presente invención, se proporciona un compuesto de fórmula (I):



(I),

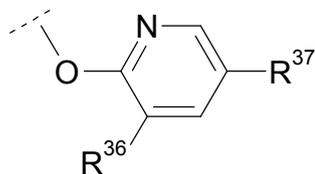
donde:

R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi;

5 R² es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo, fluoroetilo, vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo, 2-(ciclopropil)etinilo, halógeno, metoxi, prop-2-inilo o (fluoroalquil C₁-C₂)metoxi-;

o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;

10 o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;



o R² es , en donde R³⁶ es flúor o cloro, y R³⁷ es flúor, cloro o fluoroalquilo C₁; y

R³ es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, isopropoxi, fluoroalcoxi C₁-C₂, (alcoxi C₁-C₂)-(alcoxi C₁-C₃)- o (fluoroalcoxi C₁)-(alcoxi C₁-C₃)-;

15 R⁴, R⁵ y R⁶ son, independientemente unos de otros, hidrógeno, alquilo C₁-C₅ (en particular alquilo C₁-C₄, p. ej., alquilo C₁-C₂), alqueno C₂-C₃ (en particular etenil-CH₂-), alquino C₂-C₃ (en particular etinil-CH₂-), fluoroalquilo C₁-C₂ o (alcoxi C₁-C₂)alquilo C₁-C₂;

siempre que: (i) al menos dos de los grupos R⁴, R⁵ y R⁶ sean hidrógeno, o (ii) dos de los grupos R⁴, R⁵ y R⁶ sean metilo y el restante de los grupos R⁴, R⁵ y R⁶ sea hidrógeno; y

20 R⁷ y R⁸ son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, flúor o alquilo C₁-C₃ (preferentemente hidrógeno o metilo); y

R⁹ y R¹⁰ son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, flúor o alquilo C₁-C₃ (preferentemente hidrógeno, metilo o etilo);

siempre que no más de dos (preferentemente ninguno) de los grupos R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ sean flúor;

y siempre que al menos dos (preferentemente tres o todos) de los grupos R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ sean hidrógeno;

25 y donde

R¹¹ es alquilo C₁-C₆ (en particular alquilo C₃-C₅ tal como *tert*-butilo), cicloalquilo C₃-C₇ (en particular cicloalquilo C₄-C₆, más en particular ciclohexilo), tetrahidro-2*H*-piranilo (tal como tetrahidro-2*H*-piran-4-ilo, tetrahidro-2*H*-piran-3-ilo o

tetrahidro-2*H*-piran-2-ilo), tetrahidrofuranilo (tal como tetrahidrofuran-3-ilo o tetrahidrofuran-2-ilo), oxetanilo (tal como oxetan-3-ilo o oxetan-2-ilo), tetrahidrotiofen-ilo (tal como tetrahidrotiofen-3-ilo o tetrahidrotiofen-2-ilo) o tietanilo (tal como tietan-3-ilo o tietan-2-ilo);

5 o R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico, el cual está unido mediante carbono (es decir, unido mediante un carbono anular) y el cual es piridinilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo o 1,2,4-triazinilo, donde el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes;

10 donde dichos 1, 2 o 3 sustituyentes opcionales en el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico son independientemente flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciclopropilo, (alcoxi C_{n1})(alquilo C_{n2}) (donde n₁ es 1 o 2, n₂ es 1 o 2 y n₁+n₂ es 2 o 3), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃, fluoroetinilo, ciano, amino o fenilo donde el fenilo está opcionalmente sustituido en su posición o posiciones meta y/o para con 1 o 2 átomos de flúor; y

15 donde, cuando R¹¹ es pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo o 1,2,4-triazinilo, entonces cada uno de ellos está opcionalmente sustituido con 1 o 2 de los sustituyentes en el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico, según se definen en la presente;

donde, cuando R¹¹ es piridin-3-ilo o piridin-4-ilo, entonces cada uno de ellos está sustituido con 1 o 2 de los sustituyentes en el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico, según se definen en la presente,

donde, cuando R¹¹ es piridin-2-ilo sustituido con 3 sustituyentes, entonces uno o más de los sustituyentes opcionales en el piridin-2-ilo es o son flúor;

20 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con alquilo C₂, fluoroalquilo C₂, alcoxi C₂ o fluoroalcoxi C₂, entonces: el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico está sustituido con 1 o 2 sustituyentes que son independientemente alquilo C₂, fluoroalquilo C₂, alcoxi C₂ o fluoroalcoxi C₂, y el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico está opcionalmente sustituido además con 1 o 2 sustituyentes que son independientemente flúor, cloro, bromo, alquilo C₁, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁, fluoroalcoxi C₁ o ciano; siempre que el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico no esté sustituido con más de 2 sustituyentes o, en el caso de un piridin-2-ilo, no esté sustituido con más de 3 sustituyentes;

30 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con yodo, alquilo C₃, fluoroalquilo C₃, ciclopropilo, (alcoxi C_{n1})(alquilo C_{n2}), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃ o fluoroetinilo, entonces: el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es piridin-2-ilo sustituido con un solo yodo, alquilo C₃, fluoroalquilo C₃, ciclopropilo, (alcoxi C_{n1})(alquilo C_{n2}), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃ o fluoroetinilo, y donde el anillo de piridin-2-ilo está opcionalmente sustituido además con 1 o 2 átomos de flúor;

35 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con amino, entonces: o bien el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es 6-aminopiridin-2-ilo opcionalmente sustituido además con 1 o 2 átomos de flúor; o el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es 3-aminopiridin-2-ilo o 3-aminopirazin-2-ilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido además en la posición 5 del anillo de piridin-2-ilo o pirazin-2-ilo con hidrógeno, flúor, metilo o fluoroalquilo C₁; y

40 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con fenilo opcionalmente sustituido, entonces el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es 6-fenilpiridin-2-ilo donde el fenilo está opcionalmente sustituido en su posición o posiciones meta y/o para con 1 o 2 átomos de flúor; y donde el anillo de piridin-2-ilo está opcionalmente sustituido además con 1 o 2 átomos de flúor; o R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico, el cual está unido mediante carbono (es decir, unido mediante un carbono anular) y el cual es pirrolilo, pirazolilo, imidazol-2-ilo, triazolilo (p. ej. 1,2,3- o 1,2,4-triazolilo), tetrazolilo, furilo, tiofenilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxadiazolilo (p. ej. 1,2,3-, 1,2,4-, 1,2,5- o 1,3,4- oxadiazolilo) o tiadiazolilo (p. ej. 1,2,3-, 1,2,4-, 1,2,5- o 1,3,4- tiadiazolilo), donde el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico está
45 opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes;

donde dichos 1, 2 o 3 sustituyentes opcionales en el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico son:

1, 2 o 3 sustituyentes opcionales de un carbono anular que son independientemente flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciclopropilo, (alcoxi C_{n3})(alquilo C_{n4}) (donde n₃ es 1 o 2, n₄ es 1 o 2 y n₃+n₄ es 2 o 3), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃, fluoroetinilo o ciano; y/o

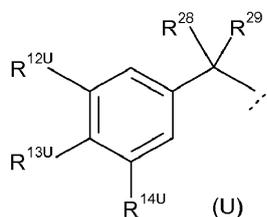
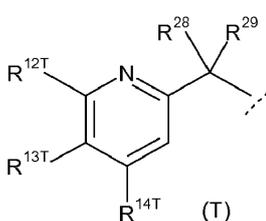
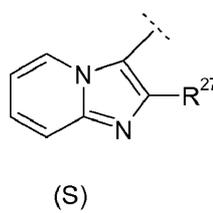
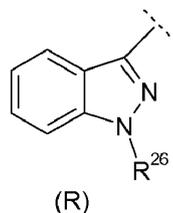
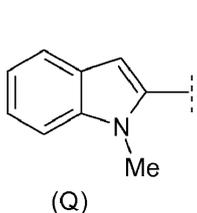
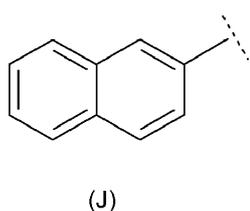
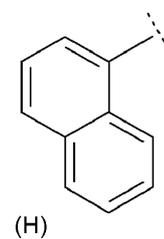
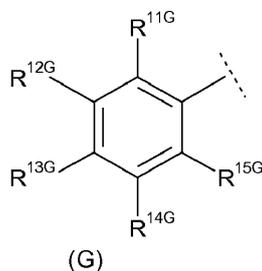
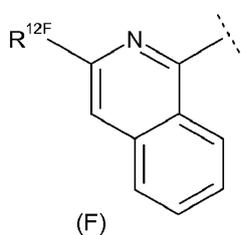
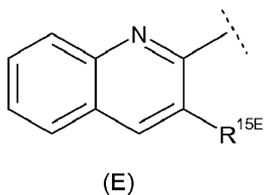
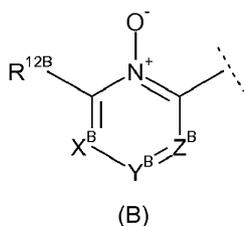
1 sustituyente que es alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃ o ciclopropilo, sustituido en un nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace, donde el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico tiene un nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace (en particular pirrolilo, pirazolilo, imidazol-2-ilo, triazolilo o tetrazolilo);

5 siempre que el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tenga más de 3 sustituyentes o no tenga más de un número máximo de sustituyentes posibles para el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico en forma no cargada si este máximo es inferior a 3 sustituyentes; y

10 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico que tiene un nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace (en particular pirrolilo, pirazolilo, imidazol-2-ilo, triazolilo o tetrazolilo), entonces el nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace está sustituido con alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃ o ciclopropilo; y

15 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico, entonces: el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tiene más de un sustituyente de tipo fluoroalquilo C₃, vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃ o fluoroetenilo; el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tiene más de 2 sustituyentes que son independientemente bromo, alquilo C₂-C₃, fluoroalquilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciclopropilo, (alcoxi C_{n3})(alquilo C_{n4}), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃, fluoroetinilo o ciano; y el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tiene más de 2 sustituyentes que son independientemente cloro o bromo;

o R¹¹ es una de las siguientes fórmulas B, E, F, G, H, J, Q, R, S, T o U:



donde:

X^B es nitrógeno o CR^{13B} ; (preferentemente, X^B es CR^{13B});

Y^B es nitrógeno o CR^{14B} ; (preferentemente, Y^B es CR^{14B});

Z^B es nitrógeno o CR^{15B} ; (preferentemente, Z^B es CR^{15B});

5 siempre que no más de uno de los grupos X^B , Y^B y Z^B sea nitrógeno; (preferentemente ninguno de los grupos X^B , Y^B y Z^B es nitrógeno); y

R^{12B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; (preferentemente R^{12B} es hidrógeno);

R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), ciano, metoxi o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi);

10 (preferentemente R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ; más preferentemente, R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi); aún más preferentemente R^{13B} es hidrógeno);

R^{14B} es hidrógeno, flúor o cloro (más preferentemente R^{14B} es hidrógeno);

15 R^{15B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; (más preferentemente R^{15B} es hidrógeno, flúor o cloro; aún más preferentemente R^{15B} es hidrógeno);

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12B} , R^{13B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno;

20 y siempre que, cuando R^{13B} sea bromo, entonces X^A sea CR^{13B} , y R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} son hidrógeno y/o Y^B es CR^{14B} y/o Z^B es CR^{15B}); y

R^{15E} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno);

R^{12F} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno);

R^{11G} es hidrógeno, flúor, metilo o fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo);

(preferentemente R^{11G} es hidrógeno o flúor; aún más preferentemente R^{11G} es hidrógeno);

25 R^{12G} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente R^{12G} es hidrógeno);

R^{13G} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), metoxi o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi);

(preferentemente R^{13G} es hidrógeno, flúor o fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo); aún más preferentemente R^{13G} es hidrógeno);

30 R^{14G} es hidrógeno o flúor; (preferentemente R^{14G} es hidrógeno);

R^{15G} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ; (preferentemente R^{15G} es hidrógeno o flúor; más preferentemente R^{15G} es hidrógeno);

siempre que, cuando R^{13G} sea bromo, entonces R^{11G} , R^{12G} , R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor;

35 siempre que, cuando R^{11G} sea metilo o fluoroalquilo C_1 , entonces R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor; y

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean hidrógeno; y

R^{26} es hidrógeno o metilo;

R^{27} es hidrógeno o metilo;

40 R^{28} y R^{29} son independientemente hidrógeno o flúor; (preferentemente ambos son hidrógeno);

R^{12T} , R^{13T} y R^{14T} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o preferentemente tres) de los grupos R^{12T} , R^{13T} y R^{14T} sean hidrógeno; y

R^{12U} , R^{13U} y R^{14U} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o

preferentemente tres) de los grupos R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} sean hidrógeno;

y donde:

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

5 G es -C(X^a)-R^a, -C(X^b)-X^c-R^b, -C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g, -CH₂-X^f-R^h o -CH(Me)-X^f-R^h; o fenil-CH₂- o fenil-CH(alquil C₁-C₂)- (en cada uno de los cuales el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, C₁fluoroalcoxi, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o heteroaril-CH₂- o heteroaril-CH(alquil C₁-C₂)- (en cada uno de los cuales el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o fenil-C(O)-CH₂- (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro); o (alcoxi C₁-C₆)-C(O)-CH₂-, (alquil C₁-C₆)-C(O)-CH₂-, (alcoxi C₁-C₆)-C(O)-CH=CH-, (alquen C₂-C₇)-1-il-CH₂-, (alquen C₂-C₇)-1-il-CH(alquil C₁-C₂)-, (fluoroalquen C₂-C₄)-1-il-CH₂-, (alquin C₂-C₇)-1-il-CH₂- o (alquin C₂-C₇)-1-il-CH(alquil C₁-C₂)-

donde X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son independientemente unos de otros oxígeno o azufre (preferentemente oxígeno); y donde

15 R^a es H, alquilo C₁-C₂₁, alquenilo C₂-C₂₁, alquinilo C₂-C₁₈, fluoroalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, (alquilamino C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)(alquilo C₁-C₅), (cicloalquilo C₃-C₇)(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alqueniloxi C₃-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquiniloxi C₃-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquiltio C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfín C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfonil C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilidenaminox C₂-C₈)(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), aminocarbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquilamino C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonilamino-(alquilo C₁-C₅), N-(alquil C₁-C₅)carbonil-N-(alquilamino C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (trialquilsilil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₅), fenil(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfín C₁-C₃, alquilsulfonil C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfín C₁-C₃, alquilsulfonil C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

30 R^b es alquilo C₁-C₁₈, alquenilo C₃-C₁₈, alquinilo C₃-C₁₈, fluoroalquilo C₂-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, (alquilamino C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)(alquilo C₁-C₅), (cicloalquilo C₃-C₇)(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alqueniloxi C₃-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquiniloxi C₃-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquiltio C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfín C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfonil C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilidenaminox C₂-C₈)(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), aminocarbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquilamino C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonilamino-(alquilo C₁-C₅), N-(alquil C₁-C₅)carbonil-N-(alquilamino C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (trialquilsilil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₅), fenil(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfín C₁-C₃, alquilsulfonil C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfín C₁-C₃, alquilsulfonil C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalquenilo C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

45 R^c y R^d son cada uno independientemente el uno del otro, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₃-C₁₀, alquinilo C₃-C₁₀, fluoroalquilo C₂-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, (alquilamino C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)(alquilo C₁-C₅), (cicloalquil C₃-C₇)(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alqueniloxi C₃-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquiniloxi C₃-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquiltio C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfín C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfonil C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (alquilidenaminox C₂-C₈)(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquilamino C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonilamino-(alquilo C₁-C₅), N-(alquil C₁-C₅)carbonil-N-(alquilamino C₁-C₅)(alquilo C₁-C₅), (trialquilsilil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₅), fenil(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfín C₁-C₃, alquilsulfonil C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfín C₁-C₃, alquilsulfonil C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo

(trialquilsilil C₃-C₆)-(alquilo C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fenoxialquilo C₁-C₅ (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroariloxi-(alquilo C₁-C₅)(donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalquenilo C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; (alquil C₁-C₆)-C(O)-; (alcoxi C₁-C₆)-C(O)-; o fenil-C(O)- donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro;

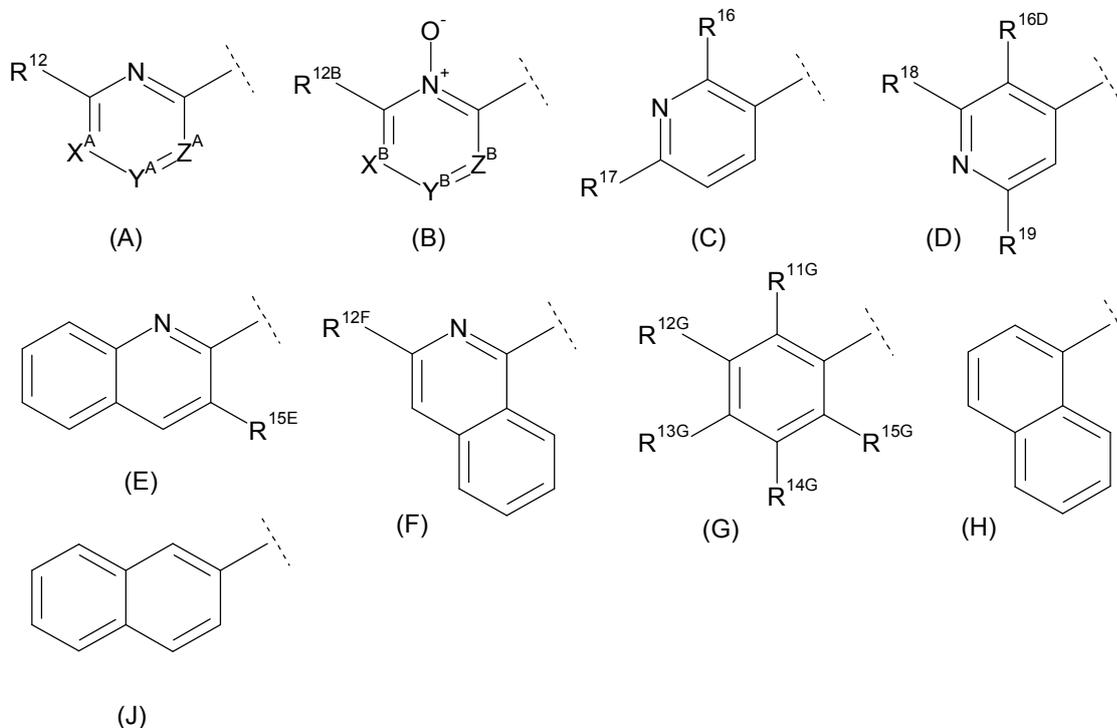
donde el término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo anular y está constituido por un único anillo o por dos anillos condensados;

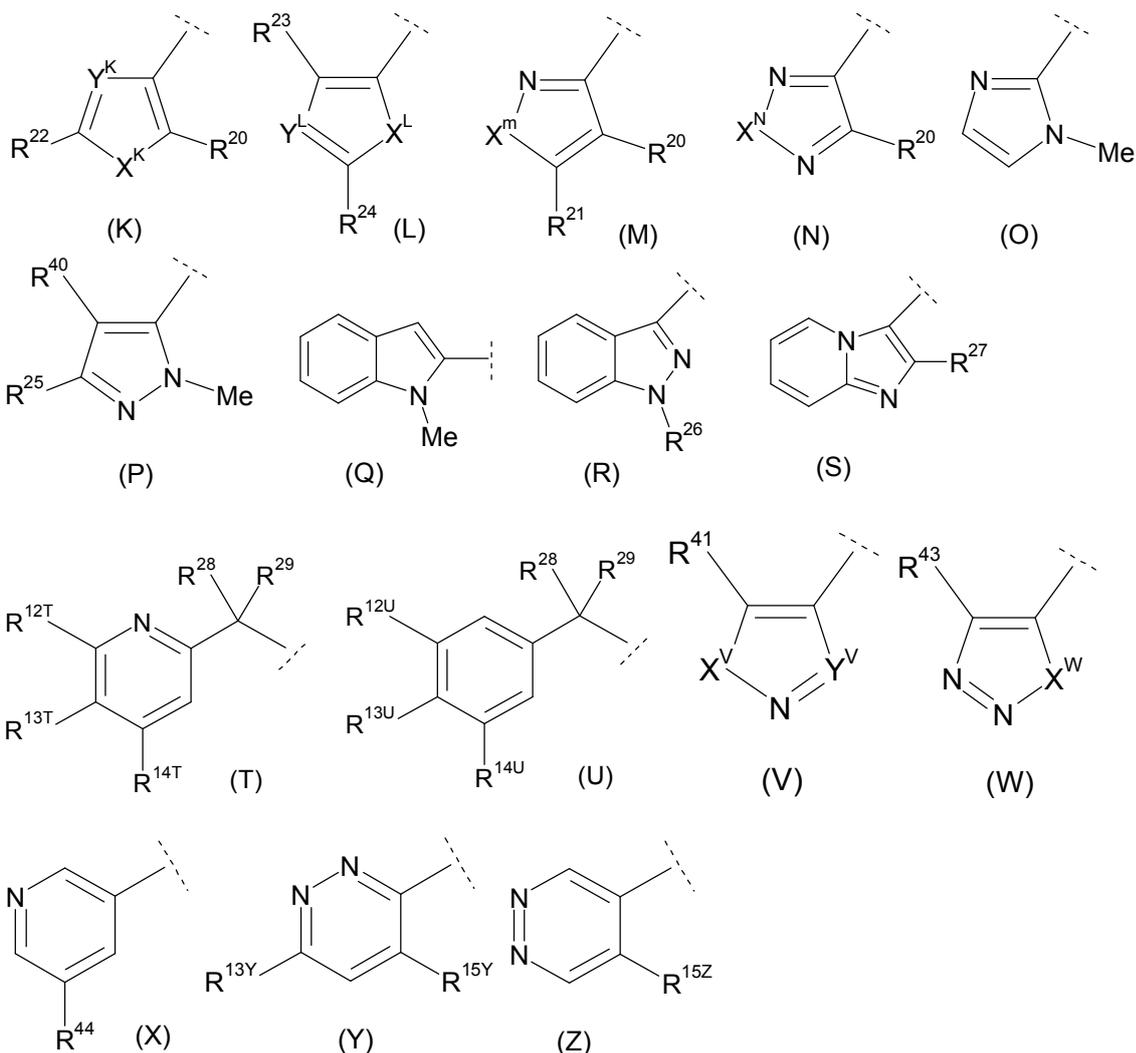
y donde el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente (p. ej., cuando sea químicamente posible) como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, en el compuesto de fórmula (I), R¹¹ es como se define a continuación :

R¹¹ es alquilo C₁-C₆ (en particular alquilo C₃-C₅ tal como *tert*-butilo), cicloalquilo C₃-C₇ (en particular cicloalquilo C₄-C₆, más en particular ciclohexilo), tetrahidro-2*H*-piranilo (tal como tetrahidro-2*H*-piran-4-ilo, tetrahidro-2*H*-piran-3-ilo o tetrahidro-2*H*-piran-2-ilo), tetrahidrofuranilo (tal como tetrahidrofuran-3-ilo o tetrahidrofuran-2-ilo), oxetanilo (tal como oxetan-3-ilo o oxetan-2-ilo), tetrahidrotiofen-ilo (tal como tetrahidrotiofen-3-ilo o tetrahidrotiofen-2-ilo) o tietanilo (tal como tietan-3-ilo o tietan-2-ilo);

o R¹¹ es una de las siguientes subfórmulas A, B, C, D, E, F, G, H, J, K, L, M, N, O, P, Q, R, S, T, U, V, W, X, Y o Z:





donde:

5 X^A es nitrógeno o CR^{13} ;

Y^A es nitrógeno o CR^{14} ;

Z^A es nitrógeno o CR^{15} ;

siempre que no más de uno de los grupos X^A , Y^A y Z^A sea nitrógeno; (preferentemente ninguno de los grupos X^A , Y^A y Z^A es nitrógeno); y

10 R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C_1 - C_2 (p. ej., metilo), fluoroalquilo C_1 - C_2 (p. ej., fluoroalquilo C_1 tal como trifluorometilo), alcoxi C_1 - C_2 (p. ej., metoxi), fluoroalcoxi C_1 - C_2 (p. ej., fluoroalcoxi C_1 tal como trifluorometoxi o difluorometoxi), ciano, amino o fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones meta y/o para con 1 o 2 sustituyentes flúor;

(preferentemente R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; aún más preferentemente R^{12} es hidrógeno);

15 R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalquilo C_2 , vinilo, fluoroalquenilo C_2 , alquínilo C_2 - C_3 , fluoroetnilo, ciano, metoxi, etoxi, fluoroalcoxi C_1 o fluoroalcoxi C_2 ;

(preferentemente R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), ciano, metoxi o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi); más preferentemente R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ; incluso más preferentemente, R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi); aún más preferentemente R^{13} es hidrógeno);

20 R^{14} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano;

(preferentemente R^{14} es hidrógeno, flúor o cloro; más preferentemente R^{14} es hidrógeno);

R^{15} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C_1 - C_2 (p. ej., metilo), fluoroalquilo C_1 , metoxi, fluoroalcoxi C_1 (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi), ciano o amino;

5 (preferentemente R^{15} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; más preferentemente R^{15} es hidrógeno, flúor o cloro; aún más preferentemente R^{15} es hidrógeno);

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

10 y siempre que, cuando R^{12} sea yodo, amino o fenilo opcionalmente sustituido, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{13} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{13} , R^{14} y R^{15} son hidrógeno);

y siempre que, cuando R^{13} sea bromo, entonces X^A sea CR^{13} , y R^{12} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} son hidrógeno y/o Y^A es CR^{14} y/o Z^A es CR^{15});

15 y siempre que, cuando R^{13} sea etilo, fluoroalquilo C_2 , vinilo, fluoroalqueno C_2 , alqueno C_2 - C_3 , fluoroetilo, etoxi o fluoroalcoxi C_2 , entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{12} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} son hidrógeno);

20 y siempre que, cuando R^{14} sea bromo o ciano, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{12} , R^{13} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{13} y R^{15} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{12} , R^{13} y R^{15} son hidrógeno);

y siempre que, cuando R^{15} sea amino, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea nitrógeno o CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{13} sea hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 (p. ej., H, Me o trifluorometilo), y R^{12} y R^{14} sean hidrógeno;

y donde:

25 X^B es nitrógeno o CR^{13B} ; (preferentemente, X^B es CR^{13B});

Y^B es nitrógeno o CR^{14B} ; (preferentemente, Y^B es CR^{14B});

Z^B es nitrógeno o CR^{15B} ; (preferentemente, Z^B es CR^{15B});

siempre que no más de uno de los grupos X^B , Y^B y Z^B sea nitrógeno; (preferentemente ninguno de los grupos X^B , Y^B y Z^B es nitrógeno); y

30 R^{12B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; (preferentemente R^{12B} es hidrógeno);

R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), ciano, metoxi o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi);

35 (preferentemente R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ; más preferentemente, R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi); aún más preferentemente R^{13B} es hidrógeno);

R^{14B} es hidrógeno, flúor o cloro (más preferentemente R^{14B} es hidrógeno);

R^{15B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; (más preferentemente R^{15B} es hidrógeno, flúor o cloro; aún más preferentemente R^{15B} es hidrógeno);

40 siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12B} , R^{13B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{13B} sea bromo, entonces X^A sea CR^{13B} , y R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} son hidrógeno y/o Y^B es CR^{14B} y/o Z^B es CR^{15B}); y

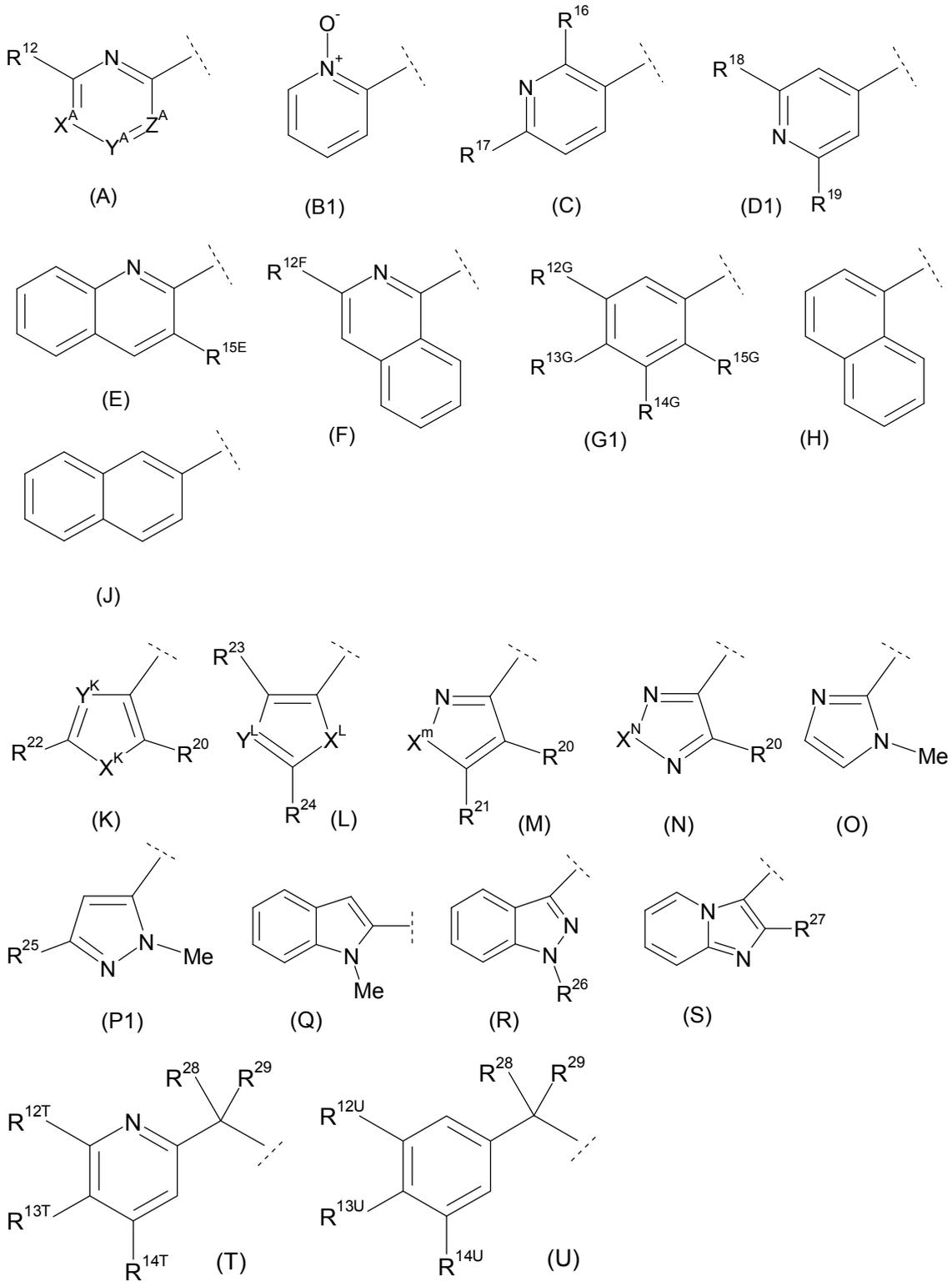
45 R^{16} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o fluoroalquilo C_1 (preferentemente hidrógeno, cloro, metilo o fluoroalquilo C_1);

R^{17} es hidrógeno, flúor, cloro, metilo o fluoroalquilo C_1 (preferentemente hidrógeno, cloro o fluoroalquilo C_1);

siempre que no más de uno de los grupos R^{16} y R^{17} sea hidrógeno;

- y siempre que cuando R¹⁶ sea bromo entonces R¹⁷ sea hidrógeno o flúor;
- R^{16D} es hidrógeno o flúor (preferentemente hidrógeno);
- R¹⁸ es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente cloro);
- R¹⁹ es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi, fluoroalcoxi C₁, metilo o fluoroalquilo C₁ (preferentemente cloro, metoxi o fluoroalcoxi C₁);
- 5 siempre que no más de uno (preferentemente ninguno) de los grupos R¹⁸ y R¹⁹ sea hidrógeno;
- R^{15E} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno);
- R^{12F} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno);
- R^{11G} es hidrógeno, flúor, metilo o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo);
- 10 (preferentemente R^{11G} es hidrógeno o flúor; aún más preferentemente R^{11G} es hidrógeno);
- R^{12G} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente R^{12G} es hidrógeno);
- R^{13G} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo), metoxi o fluoroalcoxi C₁ (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi);
- 15 (preferentemente R^{13G} es hidrógeno, flúor o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo); aún más preferentemente R^{13G} es hidrógeno);
- R^{14G} es hidrógeno o flúor; (preferentemente R^{14G} es hidrógeno);
- R^{15G} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi o fluoroalcoxi C₁; (preferentemente R^{15G} es hidrógeno o flúor; más preferentemente R^{15G} es hidrógeno);
- siempre que, cuando R^{13G} sea bromo, entonces R^{11G}, R^{12G}, R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor;
- 20 siempre que, cuando R^{11G} sea metilo o fluoroalquilo C₁, entonces R^{12G}, R^{13G}, R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor; y
- siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12G}, R^{13G}, R^{14G} y R^{15G} sean hidrógeno;
- X^K es O o S; e Y^K es C-H o N (preferentemente, Y^K es N);
- 25 X^L es O, S o N-Me; e Y^L es C-H o N; siempre que cuando X^L sea N-Me entonces Y^L no sea N (preferentemente, cuando X^L es O o S, entonces Y^L es N; más preferentemente, X^L es S; aún más preferentemente, X^L es S e Y^L es N);
- X^m es O, S o N-Me (preferentemente, X^m es N-Me);
- X^N es O, S o N-Me;
- X^V es O, S o N-Me (preferentemente, X^V es S o N-Me); e Y^V es N o CR⁴²; y
- 30 X^W es O, S o N-Me (en particular, X^W puede ser O o S);
- R²⁰ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro (en particular H, Me, difluorometilo, trifluorometilo, flúor o cloro);
- R²¹ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, etilo, ciclopropilo, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, flúor o cloro);
- 35 R²² es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro (en particular H, Me, difluorometilo, trifluorometilo, flúor o cloro);
- R²³ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, etilo o ciclopropilo (en particular H, Me, difluorometilo, trifluorometilo, etilo o ciclopropilo; preferentemente difluorometilo, trifluorometilo o ciclopropilo);
- R²⁴ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, etilo o metoximetilo (en particular H, Me, difluorometilo, trifluorometilo, etilo o metoximetilo; preferentemente difluorometilo, trifluorometilo o metoximetilo);
- 40 R²⁵ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro (en particular H, Me, difluorometilo, trifluorometilo, preferentemente metilo, difluorometilo o trifluorometilo, aún más preferentemente trifluorometilo);

- R²⁶ es hidrógeno o metilo; y
- R²⁷ es hidrógeno o metilo; y
- R²⁸ y R²⁹ son independientemente hidrógeno o flúor; (preferentemente ambos son hidrógeno);
- 5 R⁴⁰ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro (en particular hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, flúor o cloro, preferentemente hidrógeno, flúor o cloro);
- R⁴¹ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro (en particular hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, flúor o cloro, preferentemente metilo, trifluorometilo o cloro);
- R⁴² es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro (en particular hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, flúor o cloro, preferentemente metilo, trifluorometilo o cloro);
- 10 R⁴³ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular hidrógeno, metilo, difluorometilo o trifluorometilo, preferentemente metilo o trifluorometilo);
- R⁴⁴ es flúor, cloro o bromo (preferentemente cloro);
- R^{12T}, R^{13T} y R^{14T} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o preferentemente tres) de los grupos R^{12T}, R^{13T} y R^{14T} sean hidrógeno; y
- 15 R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o preferentemente tres) de los grupos R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} sean hidrógeno; y
- R^{13Y} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo), metoxi o fluoroalcoxi C₁ (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi);
- 20 (preferentemente R^{13Y} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalcoxi C₁ (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi); más preferentemente R^{13Y} es hidrógeno, cloro o bromo);
- R^{15Y} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metoxi o fluoroalcoxi C₁; (preferentemente R^{15Y} es hidrógeno o flúor; más preferentemente R^{15Y} es hidrógeno);
- siempre que uno o ambos grupos R^{13Y} y R^{15Y} sean independientemente hidrógeno o flúor; y
- R^{15Z} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente R^{15Z} es hidrógeno o flúor);
- 25 y donde el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente (p. ej., cuando sea químicamente posible) como una de sus sales agroquímicamente aceptables.
- Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, en el compuesto de fórmula (I), R² y/o R¹¹ y/o G y/o R^h (aún más preferentemente R² y R¹¹ y G y R^h) son como se definen a continuación:
- 30 R² es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo, fluoroetilo, vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo, 2-(ciclopropil)etinilo, halógeno o (fluoroalquil C₁-C₂)metoxi-;
- o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;
- 35 o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro; y/o
- R¹¹ es alquilo C₁-C₆ (en particular alquilo C₃-C₅ tal como *tert*-butilo), cicloalquilo C₃-C₇ (en particular cicloalquilo C₄-C₆, más particularmente ciclohexilo), tetrahidro-2*H*-piranilo (tal como tetrahidro-2*H*-piran-4-ilo, tetrahidro-2*H*-piran-3-ilo o tetrahidro-2*H*-piran-2-ilo) o tetrahidrofuranilo (tal como tetrahidrofuran-3-ilo o tetrahidrofuran-2-ilo);
- o R¹¹ es una de las siguientes subfórmulas A, B1, C, D1, E, F, G1, H, J, K, L, M, N, O, P1, Q, R, S, T o U:



donde:

5 X^A es nitrógeno o CR^{13} ;

Y^A es nitrógeno o CR^{14} ;

Z^A es nitrógeno o CR^{15} ;

siempre que no más de uno de los grupos X^A , Y^A y Z^A sea nitrógeno; (preferentemente ninguno de los grupos X^A , Y^A y Z^A es nitrógeno); y

- R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C_1 - C_2 (p. ej., metilo), fluoroalquilo C_1 - C_2 (p. ej., fluoroalquilo C_1 tal como trifluorometilo), alcoxi C_1 - C_2 (p. ej., metoxi), fluoroalcoxi C_1 - C_2 (p. ej., fluoroalcoxi C_1 tal como trifluorometoxi o difluorometoxi), ciano, amino o fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones meta y/o para con 1 o 2 sustituyentes flúor;
- 5 (preferentemente R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; más preferentemente R^{12} es hidrógeno);
- R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo) o ciano;
- (preferentemente R^{13} es hidrógeno, flúor, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo) o ciano; más preferentemente, R^{13} es hidrógeno, flúor, fluoroalquilo C_1 o ciano; aún más preferentemente R^{13} es hidrógeno);
- R^{14} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- 10 (preferentemente R^{14} es hidrógeno, flúor o cloro; más preferentemente R^{14} es hidrógeno);
- R^{15} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C_1 - C_2 (p. ej., metilo), fluoroalquilo C_1 , metoxi, fluoroalcoxi C_1 (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi), ciano o amino;
- (preferentemente R^{15} es hidrógeno, flúor o cloro; más preferentemente R^{15} es hidrógeno);
- 15 siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;
- y siempre que, cuando R^{12} sea yodo, amino o fenilo opcionalmente sustituido, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{13} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno; (preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{13} , R^{14} y R^{15} son hidrógeno);
- 20 y siempre que, cuando R^{15} sea amino, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea nitrógeno o CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{13} sea hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 (p. ej., H, Me o trifluorometilo), y R^{12} y R^{14} sean hidrógeno; y
- R^{16} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno o cloro);
- R^{17} es hidrógeno, flúor, cloro, metilo o fluoroalquilo C_1 (preferentemente hidrógeno, cloro o fluoroalquilo C_1);
- siempre que no más de uno de los grupos R^{16} y R^{17} sea hidrógeno;
- 25 R^{18} es cloro;
- R^{19} es flúor, cloro, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo o fluoroalquilo C_1 (preferentemente cloro, metoxi o fluoroalcoxi C_1);
- R^{15E} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno);
- R^{12F} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente hidrógeno);
- R^{12G} es hidrógeno, flúor o cloro (preferentemente R^{12G} es hidrógeno);
- 30 R^{13G} es hidrógeno, flúor, cloro, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), metoxi o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., trifluorometoxi o difluorometoxi);
- (preferentemente R^{13G} es hidrógeno, flúor o fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo); aún más preferentemente R^{13G} es hidrógeno);
- R^{14G} es hidrógeno o flúor; (preferentemente R^{14G} es hidrógeno);
- 35 R^{15G} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ; (preferentemente R^{15G} es hidrógeno o flúor; más preferentemente R^{15G} es hidrógeno);
- siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos; preferentemente tres o todos, aún más preferentemente todos) de los grupos R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean hidrógeno;
- X^K es O o S; e Y^K es C-H o N (preferentemente, Y^K es N);
- 40 X^L es O, S o N-Me; e Y^L es C-H o N; siempre que cuando X^L sea N-Me entonces Y^L no sea N (preferentemente, cuando X^L no es N-Me, entonces Y^L es N);
- X^m es O, S o N-Me;
- X^N es O, S o N-Me;

- R²⁰ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular H, Me o trifluorometilo);
- R²¹ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular H, Me o trifluorometilo);
- R²² es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular H, Me o trifluorometilo);
- R²³ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular H, Me o trifluorometilo);
- 5 R²⁴ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular H, Me o trifluorometilo);
- R²⁵ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁ (en particular H, Me o trifluorometilo);
- R²⁶ es hidrógeno o metilo; y
- R²⁷ es hidrógeno o metilo; y
- R²⁸ y R²⁹ son independientemente hidrógeno o flúor; (preferentemente ambos son hidrógeno);
- 10 R^{12T}, R^{13T} y R^{14T} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o preferentemente tres) de los grupos R^{12T}, R^{13T} y R^{14T} sean hidrógeno; y
- R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o preferentemente tres) de los grupos R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} sean hidrógeno;
- y/o
- 15 G es hidrógeno; un metal agrícolamente aceptable, o un grupo sulfonio o amonio agrícolamente aceptable; o
- G es -C(X^a)-R^a, -C(X^b)-X^c-R^b, -C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o -CH₂-X^f-R^h; o fenil-CH₂- o fenil-CH(alquil C₁-C₂)- (en cada uno de los cuales el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o heteroaril-CH₂- o heteroaril-CH(alquil C₁-C₂)- (en cada uno de los cuales el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o fenil-C(O)-CH₂- (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro); o (alcoxi C₁-C₆)-C(O)-CH₂-, (alquil C₁-C₆)-C(O)-CH₂-, (alcoxi C₁-C₆)-C(O)-CH=CH-, (alquen C₂-C₇)-1-il-CH₂-, (alquen C₂-C₇)-1-il-CH(alquil C₁-C₂)-, (fluoroalquen C₂-C₄)-1-il-CH₂-, (alquin C₂-C₇)-1-il-CH₂- o (alquin C₂-C₇)-1-il-CH(alquil C₁-C₂)-;
- 20
- 25 y/o
- R^h es alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₃-C₁₀, alquino C₃-C₁₀, fluoroalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, (alquilamino C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)-(alquilo C₁-C₅), (cicloalquilo C₃-C₇)-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alqueno C₃-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquino C₃-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquiltio C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfinil C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfonil C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquildenaminoxil C₂-C₈)-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), aminocarbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquilamino C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonilamino-(alquilo C₁-C₅), N-(alquil C₁-C₅)carbonil-N-(alquilamino C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (trialquilsilil C₃-C₆)-(alquilo C₁-C₅), fenil(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fenoxil(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroariloxil-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalqueno C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; (alquil C₁-C₆)-C(O)-; o fenil-C(O)- donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro;
- 30
- 35
- 40
- 45
- y donde, independientemente para cada una de las realizaciones preferidas anteriores de R² y/o R¹¹ y/o G y/o R^h:
- 50 el término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo anular y está constituido por un único anillo o por dos anillos condensados;
- y el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente (p. ej., cuando sea químicamente posible) como una de

sus sales agroquímicamente aceptables.

En las definiciones de los sustituyentes de los compuestos de fórmula I, cada resto alquilo solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi, alquiltio, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo o dialquilaminocarbonilo y otros) puede ser de cadena recta o ramificada. Normalmente, el alquilo es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *tert*-butilo, *n*-pentilo, neopentilo o *n*-hexilo. Los grupos alquilo pueden ser, por ejemplo, grupos alquilo C₁-C₆ (a no ser que ya se hayan definido más específicamente), pero son preferentemente grupos alquilo C₁-C₄ o alquilo C₁-C₃ (a no ser que ya se hayan definido más específicamente) y, más preferentemente, son grupos alquilo C₁-C₂ tales como metilo.

Los restos alqueno y alquino pueden estar en forma de cadenas rectas o ramificadas, y los restos alqueno, cuando proceda, pueden tener la configuración (*E*) o (*Z*). Los restos alqueno o alquino normalmente son alqueno C₂-C₃ o alquino C₂-C₃ tal como vinilo, alilo, etinilo, propargilo o prop-1-ino. Los restos alqueno y alquino pueden contener uno o más dobles y/o triples enlaces en cualquier combinación; pero preferentemente contienen solamente un doble enlace (para el alqueno) o solamente un triple enlace (para el alquino).

Halógeno equivale a flúor, cloro, bromo o yodo. Los halógenos preferidos son flúor, cloro o bromo. Más preferentemente, en varios aspectos y/o realizaciones de la invención, halógeno equivale a flúor o cloro.

Los grupos fluoroalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más (p. ej., 1, 2, 3, 4 o 5; en particular, 1, 2 o 3; p. ej., 1 o 2) átomos de flúor. Fluoroalquilo equivale normalmente a fluoroalquilo C₁-C₃ o fluoroalquilo C₁-C₂ (preferentemente fluoroalquilo C₁) tal como CF₃, CHF₂, CH₂F, CH₃CHF-, CF₃CH₂-, CHF₂CH₂-, CH₂FCH₂-, CHF₂CF₂- o (CH₃)₂CF-. Fluoroalcoxi equivale normalmente a fluoroalcoxi C₁-C₃ o fluoroalcoxi C₁-C₂ (preferentemente fluoroalcoxi C₁) tal como CF₃O, CHF₂O, CH₂FO, CH₃CHFO-, CF₃CH₂O-, CHF₂CH₂O- o CH₂FCH₂O-.

En el contexto de la presente memoria descriptiva, el término "arilo" se refiere a fenilo o naftilo. Un grupo arilo preferido es el fenilo.

El término "heteroarilo", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo anular y está constituido por un único anillo o por dos anillos condensados. Preferentemente, los anillos únicos contendrán 1, 2 o 3 heteroátomos anulares y los sistemas bicíclicos 1, 2, 3 o 4 heteroátomos anulares que se seleccionarán preferentemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Normalmente, un "heteroarilo" es furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo o indolizino; opcionalmente presentes, cuando sea químicamente posible, como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

El término "heterociclilo", tal como se utiliza en la presente, a no ser que se indique explícitamente lo contrario, se refiere a un anillo orgánico monocíclico de 4, 5, 6 o 7 (en particular, 5, 6 o 7) miembros o a un sistema anular orgánico bicíclico condensado de 8, 9, 10 o 11 (en particular, 8, 9 o 10) miembros, que está completamente saturado y que contiene uno o dos (preferentemente uno) heteroátomos anulares que se seleccionan independientemente entre oxígeno, azufre y nitrógeno. Cuando el heterociclilo contiene dos heteroátomos anulares, preferentemente los dos heteroátomos anulares están separados por al menos dos átomos de carbono anulares. Preferentemente, el heterociclilo está enlazado a un átomo de carbono anular dentro del heterociclilo. En particular, el heterociclilo puede ser tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrotiofenilo, 1,4-dioxanilo, 1,4-ditianilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, pirrolidinilo, piperidinilo o piperazinilo; más particularmente tetrahidrofuranilo (p. ej., tetrahidrofuran-2-ilo o particularmente tetrahidrofuran-3-ilo), tetrahidropiranilo (p. ej., tetrahidropiran-2-ilo, tetrahidropiran-3-ilo o particularmente tetrahidropiran-4-ilo), morfolinilo, pirrolidinilo (p. ej., pirrolidin-2-ilo o particularmente pirrolidin-3-ilo), piperidinilo (p. ej., piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo o particularmente piperidin-4-ilo) o piperazinilo. En una realización particular, el heterociclilo, cuando está opcionalmente sustituido, está opcionalmente sustituido con 1 o 2 (p. ej., 1) sustituyentes de carbono anular que son independientemente alquilo C₁-C₃ (p. ej., alquilo C₁-C₂), fluoroalquilo C₁-C₂ u oxo (=O), y/o está opcionalmente sustituido con un sustituyente alquilo C₁-C₃ (p. ej., alquilo C₁-C₂), fluoroalquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₃ (p. ej., alquilo C₁-C₂ o fluoroalquilo C₁-C₂) en un nitrógeno anular si está presente, y/o está opcionalmente sustituido por uno o dos sustituyentes oxo (=O) en un azufre anular si está presente.

Preferentemente, un cicloalquilo es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo. El (cicloalquil)alquilo es preferentemente (cicloalquil)metilo tal como (cicloalquilC₃-C₆)metilo, en particular ciclopropilmetilo. Preferentemente, cicloalqueno es ciclopropeno o ciclohexeno.

La invención también se refiere a las sales agrícolamente aceptables que los compuestos de fórmula I sean capaces de formar con bases de metales de transición, metales alcalinos y metales alcalinotérreos, aminas, bases de amonio cuaternario o bases de sulfonio terciario.

Entre los formadores de sales de metales de transición, metales alcalinos y metales alcalinotérreos, cabe destacar especialmente los hidróxidos de cobre, hierro, litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, y preferentemente los

hidróxidos, bicarbonatos y carbonatos de sodio y potasio.

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

Las bases de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales se corresponden, por ejemplo, con la fórmula [N(R_a R_b R_c R_d)]OH, donde R_a, R_b, R_c y R_d son cada uno independientemente de los demás hidrógeno o alquilo C₁-C₄. Se pueden obtener otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio aniónico.

Las bases de sulfonio terciario preferidas adecuadas para la formación de sales se corresponden, por ejemplo, con la fórmula [SR_eR_fR_g]OH, donde R_e, R_f y R_g son cada uno independientemente de los demás alquilo C₁-C₄. Se prefiere especialmente el hidróxido de trimetilsulfonio. Las bases de sulfonio adecuadas pueden obtenerse a partir de la reacción de tioéteres, en particular dialquilsulfuros, con alquilhaluros, seguida de la conversión en una base adecuada, por ejemplo, un hidróxido, mediante reacciones de intercambio aniónico.

Se debe sobreentender que en aquellos compuestos de fórmula I, en los que G sea un metal, amonio o sulfonio tal como se mencionó anteriormente y como tal represente un catión, la carga negativa correspondiente estará deslocalizada en gran parte en la unidad O-C=C-C=O.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen los hidratos que puedan formarse durante la formación de las sales.

Los grupos protectores (es decir, grupos salientes o eliminables) dentro de G (por ejemplo, sin carácter limitante, los grupos protectores en los que G es -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b y otros) se seleccionan generalmente para poder eliminarlos, normalmente mediante un proceso bioquímico, químico o físico, o una combinación de estos, para obtener el compuesto correspondiente de fórmula (I) en el que G es H, antes, durante o después (preferentemente durante o después) de aplicar el compuesto de fórmula (I) a la zona tratada (p. ej., campo) o las plantas. Los ejemplos de estos procesos incluyen la escisión enzimática u otra escisión en/sobre la planta (p. ej., escisión de restos de éster y/o carbonato), hidrólisis química y/o fotólisis. Algunos compuestos que contienen dichos grupos G en ocasiones ofrecen ciertas ventajas o propiedades técnicas diferentes tales como una penetración mejorada y/o más uniforme y/o diferente de la cutícula de las plantas tratadas, una tolerancia mayor y/o diferente de ciertos cultivos, una compatibilidad o estabilidad mejorada y/o diferente en mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, protectores contra herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas, o unas propiedades de filtración reducidas y/o diferentes en los suelos.

A continuación (y/o en general en la presente) se exponen los valores particulares y/o adecuados preferidos de los sustituyentes en el compuesto de fórmula (I) u otras características de este, en particular G, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸, R²⁹, R³⁰, R³¹, R^{31C}, R^{31B}, R^{31C}, R³², R³³, R³⁴, R³⁵, R³⁶, R³⁷, R⁴⁰, R⁴¹, R⁴², R⁴³, R⁴⁴, R^{12B}, R^{13B}, R^{14B}, R^{15B}, R^{16D}, R^{12E}, R^{15F}, R^{11G}, R^{12G}, R^{13G}, R^{14G}, R^{15G}, R^{12Y}, R^{13T}, R^{14T}, R^{12U}, R^{13U}, R^{14U}, R^{13Y}, R^{15Y}, R^{15Z}, X^A, Y^A, Z^A, X^B, Y^B, Z^B, X^K, Y^K, X^L, Y^L, X^m, X^N, X^V, Y^V, X^W, n₁, n₂, n₃, n₄, R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R^f, R^g, R^h, X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y/o X^f, y se pueden considerar de forma independiente o junto con uno o más de otros valores particulares y/o adecuados cualesquiera preferidos de los sustituyentes en el compuesto de fórmula (I) u otras características de este, y en todas y cada una de sus combinaciones posibles.

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, G no es (alquil C₁-C₆)-C(O)-CH₂-.

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, G es hidrógeno; un metal agrícolamente aceptable (p. ej., un metal alcalino o alcalinotérreo agrícolamente aceptable), o un grupo sulfonio o amonio agrícolamente aceptable; o G es -C(X^a)-R^a, -C(X^b)-X^c-R^b, -SO₂-R^e, -CH₂-X^f-R^h o CH(Me)-X^f-R^h, donde X^a, X^b, X^c, X^f, R^a, R^b, R^e y R^h son como se han definido en la presente.

Más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, G es hidrógeno; un metal agrícolamente aceptable (p. ej., un metal alcalino o alcalinotérreo agrícolamente aceptable), o un grupo sulfonio o

amonio agrícolamente aceptable; o G es $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, donde X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se han definido en la presente.

En una realización particular, G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, donde X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se han definido en la presente.

- 5 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, X^a , X^b , X^c , X^d , X^e y/o X^f son oxígeno ; y/o X^c es azufre. Más preferentemente, X^a , X^b , X^d , X^e y X^f son oxígeno ; y X^c es oxígeno o azufre. Incluso más preferentemente, X^a , X^b , X^c , X^d , X^e y X^f son oxígeno.

10 Preferentemente, R^a es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6), alquenido C_2-C_6 (p. ej., alquenido C_2-C_4), alquinilo C_2-C_6 (p. ej., alquinilo C_2-C_4), cicloalquilo C_3-C_6 o (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4). Como alternativa, preferentemente, R^a es (cicloalquil C_3-C_6)-(alquilo C_1-C_2) (en particular (cicloalquil C_3-C_6)-metil-), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo o ciano. Más preferentemente, R^a es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6), alquenido C_2-C_6 (p. ej., alquenido C_2-C_4), alquinilo C_2-C_6 (p. ej., alquinilo C_2-C_4), cicloalquilo C_3-C_6 , (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4), (cicloalquil C_3-C_6)-metil-, o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro.

20 Preferentemente, R^b es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6), (alquencil C_2-C_5)- CH_2 - (p. ej., (alquencil C_2-C_3)- CH_2 -), (alquencil C_2-C_4)- $CH(Me)$ - (p. ej., (alquencil C_2-C_3)- $CH(Me)$ -), (alquinil C_2-C_5)- CH_2 - (p. ej., (alquinil C_2-C_3)- CH_2 -), (alquinil C_2-C_4)- $CH(Me)$ - (p. ej., (alquinil C_2-C_3)- $CH(Me)$ -), cicloalquilo C_3-C_6 o (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4). Como alternativa, preferentemente, R^b es (cicloalquil C_3-C_6)-(alquilo C_1-C_2) (en particular (cicloalquil C_3-C_6)-metil-), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo o ciano. Más preferentemente, R^b es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6), (alquencil C_2-C_5)- CH_2 - (p. ej., (alquencil C_2-C_3)- CH_2 -), (alquencil C_2-C_4)- $CH(Me)$ - (p. ej., (alquencil C_2-C_3)- $CH(Me)$ -), (alquinil C_2-C_5)- CH_2 - (p. ej., (alquinil C_2-C_3)- CH_2 -), (alquinil C_2-C_4)- $CH(Me)$ - (p. ej., (alquinil C_2-C_3)- $CH(Me)$ -), cicloalquilo C_3-C_6 , (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4), (cicloalquil C_3-C_6)-metil-, o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro.

35 Preferentemente, R^e es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6 o alquilo C_1-C_4), fluoroalquilo C_1-C_{10} (p. ej., fluoroalquilo C_1-C_3), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 (p. ej., 1 o 2) de, independientemente, alquilo C_1-C_3 (p. ej., alquilo C_1-C_2), fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 (p. ej., alcoxi C_1-C_2), fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro. Más preferentemente, R^e es alquilo C_1-C_{10} (en particular alquilo C_1-C_6 o alquilo C_1-C_4).

Preferentemente, R^h es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6 o alquilo C_1-C_4), fluoroalquilo C_1-C_{10} (p. ej., fluoroalquilo C_1-C_3), (alquil C_1-C_6)- $C(O)$ - (p. ej., (alquil C_1-C_4)- $C(O)$ -), o (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)$ - (p. ej., (alcoxi C_1-C_4)- $C(O)$ -). Más preferentemente, R^h es alquilo C_1-C_4 o (alcoxi C_1-C_4)- $C(O)$ -.

- 40 Preferentemente, cuando G es $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, entonces

X^a y X^b son oxígeno,

X^c es oxígeno o azufre,

45 R^a es alquilo C_1-C_{10} , alquenido C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4), (cicloalquil C_3-C_6)-(alquilo C_1-C_2), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_3 , fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 , fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_3 , fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 , fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo o ciano; y

50 R^b es alquilo C_1-C_{10} , (alquencil C_2-C_5)- CH_2 -, (alquencil C_2-C_4)- $CH(Me)$ -, (alquinil C_2-C_5)- CH_2 -, (alquinil C_2-C_4)- $CH(Me)$ -, cicloalquilo C_3-C_6 , (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4), (cicloalquil C_3-C_6)-(alquilo C_1-C_2), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_3 , fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 , fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_3 , fluoroalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_3 , fluoroalcoxi C_1-C_2 , flúor, cloro, bromo o ciano.

55 Más preferentemente, cuando G es $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, entonces X^a , X^b y X^c son oxígeno, R^a es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6), alquenido C_2-C_6 (p. ej., alquenido C_2-C_4), alquinilo C_2-C_6 (p. ej., alquinilo C_2-C_4), cicloalquilo C_3-C_6 o (alcoxi C_1-C_4)-(alquilo C_1-C_4); y R^b es alquilo C_1-C_{10} (p. ej., alquilo C_1-C_6), (alquencil C_2-C_5)- CH_2 - (p. ej., (alquencil

C₂-C₃)-CH₂-), (alquenal C₂-C₄)-CH(Me)- (p. ej., (alquenal C₂-C₃)-CH(Me)-), (alquenal C₂-C₅)-CH₂- (p. ej., (alquenal C₂-C₃)-CH₂-), (alquenal C₂-C₄)-CH(Me)- (p. ej., (alquenal C₂-C₃)-CH(Me)-), cicloalquilo C₃-C₆ o (alcoxi C₁-C₄)-(alquilo C₁-C₄).

5 En una realización preferente, G es hidrógeno, o un metal alcalino o metal alcalinotérreo agrícolamente aceptable, o un grupo sulfonio o amonio agrícolamente aceptable. Más preferentemente, G es hidrógeno, o un metal alcalino o metal alcalinotérreo agrícolamente aceptable.

En una realización preferente, G es hidrógeno, -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b.

Aún más preferentemente, G es hidrógeno.

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención:

R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi; y

10 R² es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo, fluoroetilo, vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo o halógeno;

o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independiente, halógeno, alquilo C₁-C₂, ciano o nitro;

o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, ciano o nitro; y

15 R³ es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁).

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi.

20 Más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R¹ es metilo, etilo, etinilo, cloro, bromo o metoxi.

Más preferentemente, R¹ es metilo, etilo, cloro o bromo.

Incluso más preferentemente, R¹ es metilo o cloro.

Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R¹ es metilo.

25 Preferentemente, cuando R³ es (alcoxi C₁-C₂)-(alcoxi C₁-C₃)- o (fluoroalcoxi C₁)-(alcoxi C₁-C₃)-, entonces R³ es R^{3A}O-CH(R^{3B})-CH(R^{3C})-O-;

donde R^{3A} es alquilo C₁-C₂ (en particular metilo) o fluoroalquilo C₁ (tal como trifluorometilo);

y R^{3B} y R^{3C} son independientemente hidrógeno o metilo, siempre que uno o ambos grupos R^{3B} y R^{3C} sean hidrógeno.

Preferentemente, R^{3A} es metilo o fluoroalquilo C₁, más preferentemente metilo.

30 Preferentemente, ambos grupos R^{3B} y R^{3C} son hidrógeno.

Más preferentemente, cuando R³ es (alcoxi C₁-C₂)-(alcoxi C₁-C₃)- o (fluoroalcoxi C₁)-(alcoxi C₁-C₃)- (en particular cuando R³ es R^{3A}O-CH(R^{3B})-CH(R^{3C})-O-), entonces R³ es MeO-CH₂-CH₂-O-.

Preferentemente, cuando R³ es fluoroalcoxi C₁-C₂, entonces R³ es (fluoroalquil C₁)metoxi- tal como trifluorometilmetoxi- o difluorometilmetoxi-.

35 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁, p. ej., monofluorometoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi).

40 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁, p. ej., monofluorometoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi).

De forma alternativa o además, preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es hidrógeno, metilo, etilo, etinilo, cloro, bromo, metoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁, p. ej., monofluorometoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi), o R³ es flúor.

45 Más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es metilo, etilo, etinilo, cloro, bromo, metoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁, p. ej., monofluorometoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi), en

particular R³ es metilo, etilo, etinilo, cloro o bromo.

Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es metilo, etilo, etinilo o cloro, en particular R³ es metilo, etilo o cloro.

Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es metilo o cloro.

5 Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R³ es metilo.

Por lo tanto, más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención:

R¹ es metilo, etilo, etinilo, cloro, bromo o metoxi; o incluso más preferentemente, metilo o cloro; o aún más preferentemente metilo; y

10 R³ es metilo, etilo, etinilo, cloro, bromo, metoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁); o incluso más preferentemente metilo, etilo, etinilo o cloro; o incluso más preferentemente metilo o cloro; o aún más preferentemente metilo.

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención:

15 R² es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo, fluoroetilo, vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo, 2-(ciclopropil)etinilo, halógeno o (fluoroalquil C₁-C₂)metoxi-;

o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;

o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro.

20 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención,

R² es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo, fluoroetilo, vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo o halógeno;

o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independiente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, ciano o nitro;

25 o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, ciano o nitro.

Como alternativa o además, preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R² es metilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo o halógeno;

30 o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 (en particular 1 o 2) de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂ o ciano;

o R² es heteroarilo monocíclico (en particular piridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazol-1-ilo o 1,2,3-triazol-1-ilo) opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro. Como alternativa, preferentemente, R² es (fluoroalquil C₁)metoxi-, en particular trifluorometilmetoxi-.

35 Más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R² es metilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo o halógeno;

o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 (en particular 1 o 2) de, independiente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂ o ciano;

40 o R² es heteroarilo monocíclico (en particular piridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazol-1-ilo o 1,2,3-triazol-1-ilo) opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, ciano o nitro.

Como alternativa, además más preferentemente, R² es (fluoroalquil C₁)metoxi-, en particular trifluorometilmetoxi-.

Incluso más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R² es metilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, cloro o bromo;

45 o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂ o ciano (más preferentemente fenilo opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, halógeno o fluoroalquilo C₁; incluso más preferentemente fenilo opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente fluor

o cloro);

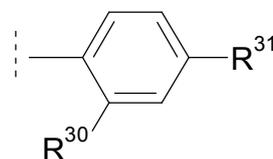
o R^2 es heteroarilo monocíclico (en particular piridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazol-1-ilo o 1,2,3-triazol-1-ilo) opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, halógeno, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 - C_2 , ciano o nitro (más preferentemente heteroarilo monocíclico (en particular piridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazol-1-ilo o 1,2,3-triazol-1-ilo) opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, halógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ; incluso más preferentemente heteroarilo monocíclico (en particular piridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazol-1-ilo o 1,2,3-triazol-1-ilo) opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, flúor, cloro, metilo o fluoroalquilo C_1).

Como alternativa, además incluso más preferentemente, R^2 es (fluoroalquil C_1)metoxi-, en particular trifluorometilmetoxi-.

Cuando R^2 es fenilo opcionalmente sustituido, entonces preferentemente el fenilo está sustituido.

Cuando R^2 es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido (en particular piridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazol-1-ilo o 1,2,3-triazol-1-ilo, cada uno opcionalmente sustituido), entonces preferentemente el heteroarilo monocíclico está sustituido.

Preferentemente, cuando R^2 es fenilo opcionalmente sustituido, entonces R^2 es



, en donde R^{30} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano; y

R^{31} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano; o R^{31} es metilo; y

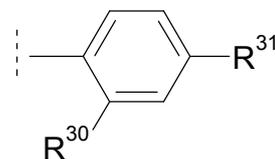
R^{31A} es flúor o cloro ;

R^{31B} es hidrógeno, flúor o cloro; y

R^{31C} es hidrógeno, flúor o cloro;

donde uno o ambos de R^{31B} y R^{31C} es o son hidrógeno.

Preferentemente, cuando R^2 es fenilo opcionalmente sustituido, entonces R^2 es



, donde R^{30} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano; y

R^{31} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano; o R^{31} es metilo.

Preferentemente, uno o ambos de R^{30} y R^{31} no es o no son hidrógeno. Más preferentemente, R^{31} no es hidrógeno.

Más preferentemente, R^{30} es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo).

Incluso más preferentemente, R^{30} es hidrógeno, flúor o cloro.

Aún más preferentemente, R^{30} es hidrógeno o flúor, en particular hidrógeno.

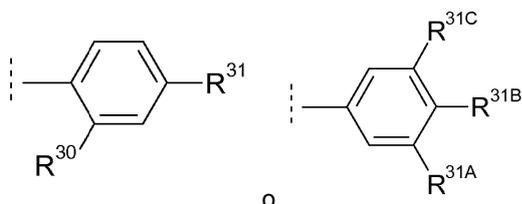
Más preferentemente, R^{31} es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo); o, además más preferentemente, R^{31} es metilo.

Aún más preferentemente, R^{31} es flúor, cloro, fluoroalquilo C_1 (p.ej., trifluorometilo) o metilo.

Aún más preferentemente, R^{31} es flúor o cloro.

Preferentemente, R^{31A} es flúor ; y/o R^{31B} es hidrógeno o flúor; y/o R^{31C} es hidrógeno o flúor ; donde uno o ambos de R^{31B} y R^{31C} es o son hidrógeno.

5 En particular preferentemente, cuando R^2 es fenilo opcionalmente sustituido, entonces R^2 es



donde:

R^{30} es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C_1 ;

R^{31} es flúor, cloro, fluoroalquilo C_1 o metilo ;

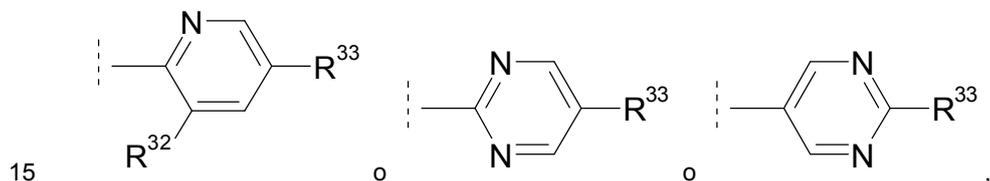
10 R^{31A} es flúor o cloro;

R^{31B} es hidrógeno, flúor o cloro ; y

R^{31C} es hidrógeno, flúor o cloro ;

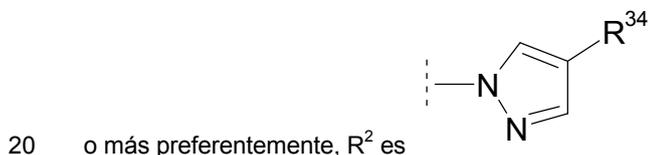
donde uno o ambos de R^{31B} y R^{31C} es o son hidrógeno.

Preferentemente, cuando R^2 es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido, entonces R^2 es



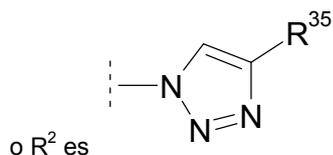
15 en donde R^{32} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano y

R^{33} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano;



20 o más preferentemente, R^2 es

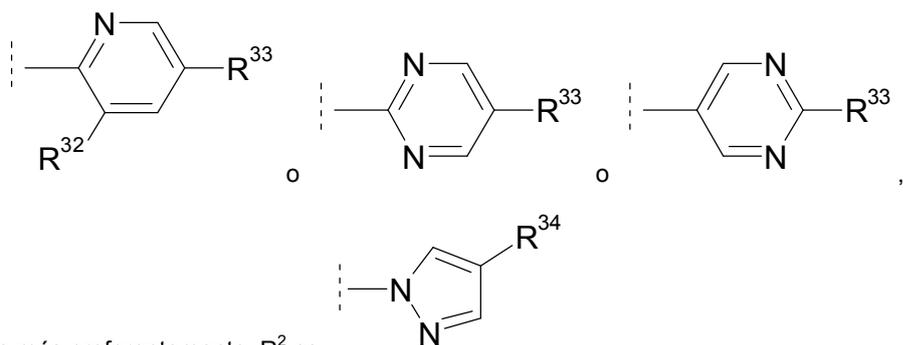
en donde R^{34} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano.



o R^2 es

25 en donde R^{35} es flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 (p. ej., trifluorometilo), fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi) o ciano.

Preferentemente, cuando R^2 es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido, entonces R^2 es



o más preferentemente, R² es

Más preferentemente, en todas las realizaciones de la invención, R³² es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo). Incluso más preferentemente, R³² es hidrógeno, flúor o cloro.

5 Aún más preferentemente, R³² es hidrógeno o flúor.

Más preferentemente, en todas las realizaciones de la invención, R³³ es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo); aún más preferentemente flúor, cloro o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo). Preferentemente, R³³ no es hidrógeno.

Aún más preferentemente, R³³ es flúor o cloro.

10 Preferentemente, en todas las realizaciones de la invención, R³⁴ es hidrógeno, flúor, cloro, metilo, fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo) o fluoroalcoxi C₁ (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi); como alternativa, además preferentemente, R³⁴ es ciano. Preferentemente, R³⁴ no es hidrógeno.

15 Como alternativa, preferentemente, en todas las realizaciones de la invención, R³⁴ es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo); como alternativa, además preferentemente, R³⁴ es ciano. Preferentemente, R³⁴ no es hidrógeno.

Más preferentemente, R³⁴ es hidrógeno, flúor, cloro, metilo o fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo); como alternativa, además más preferentemente, R³⁴ es ciano. Preferentemente, R³⁴ no es hidrógeno.

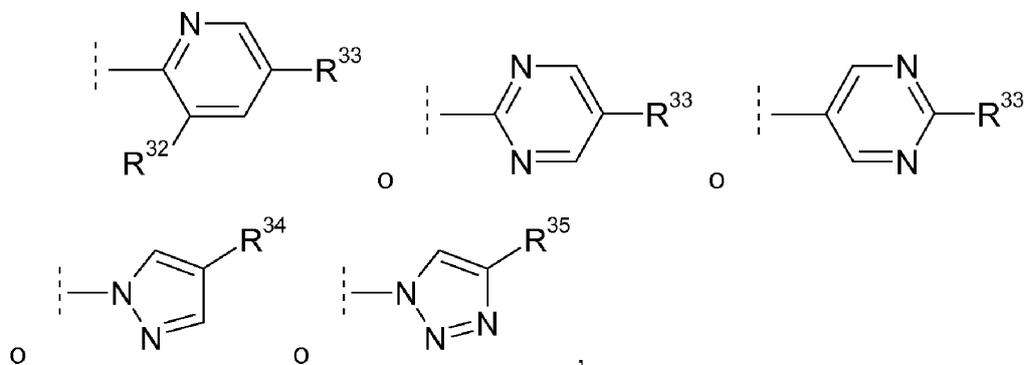
Incluso más preferentemente, R³⁴ es flúor, cloro, metilo, fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo) o ciano. Aún más preferentemente, R³⁴ es flúor, cloro o ciano.

20 Aún más preferentemente, R³⁴ es cloro. Como alternativa, se prefiere particularmente que R³⁴ sea ciano.

Preferentemente, en todas las realizaciones de la invención, R³⁵ es flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo) o ciano; y más particularmente R³⁵ es flúor, cloro, metilo, fluoroalquilo C₁ (p. ej., trifluorometilo) o ciano.

Más preferentemente, R³⁵ es cloro o ciano. Aún más preferentemente, R³⁵ es cloro.

25 En particular preferentemente, cuando R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido, entonces R² es



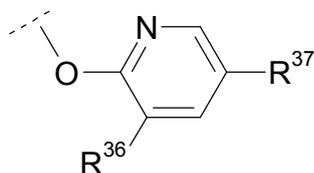
donde:

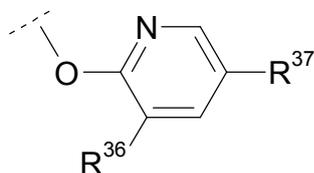
R³² es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C₁; y

R³³ es flúor, cloro o fluoroalquilo C₁;

R^{34} es flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano; y

R^{35} es flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano.



Cuando R^2 es , entonces preferentemente R^{37} es cloro o fluoroalquilo C_1 , más preferentemente fluoroalquilo C_1 (en particular trifluorometilo); y/o preferentemente R^{36} es cloro.

- 5 En la invención, R^4 , R^5 y R^6 , independientemente unos de otros, son hidrógeno, alquilo C_1 - C_5 (en particular alquilo C_1 - C_4 , p. ej., alquilo C_1 - C_2), alqueniilo C_2 - C_3 (en particular etenil- CH_2 -), alquinilo C_2 - C_3 (en particular etinil- CH_2 -), fluoroalquilo C_1 - C_2 o (alcoxi C_1 - C_2)-(alquilo C_1 - C_2) (en particular metoximetilo);

siempre que: (i) al menos dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean hidrógeno o (ii) dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean metilo y el restante de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sea hidrógeno.

- 10 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^4 , R^5 y R^6 , independientemente unos de otros, son hidrógeno, alquilo C_1 - C_2 , etenil- CH_2 -, fluoroalquilo C_1 o metoximetilo;

siempre que: (i) al menos dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean hidrógeno o (ii) dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean metilo y el restante de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sea hidrógeno.

- 15 Más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^4 , R^5 y R^6 , independientemente unos de otros, son hidrógeno o metilo;

siempre que: (i) al menos dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean hidrógeno o (ii) dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean metilo y el restante de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sea hidrógeno.

Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, todos los grupos R^4 , R^5 y R^6 son hidrógeno.

- 20 Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, todos los grupos R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son hidrógeno.

Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, todos los grupos R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son hidrógeno.

- 25 En la presente se describen características preferidas y/o particulares de R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} , R^{21} , R^{22} , R^{23} , R^{24} , R^{25} , R^{26} , R^{27} , R^{28} , R^{29} , R^{30} , R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} , R^{36} , R^{37} , R^{38} , R^{39} , R^{40} , R^{41} , R^{42} , R^{43} , R^{44} , R^{45} , R^{46} , R^{47} , R^{48} , R^{49} , R^{50} , R^{51} , R^{52} , R^{53} , R^{54} , R^{55} , R^{56} , R^{57} , R^{58} , R^{59} , R^{60} , R^{61} , R^{62} , R^{63} , R^{64} , R^{65} , R^{66} , R^{67} , R^{68} , R^{69} , R^{70} , R^{71} , R^{72} , R^{73} , R^{74} , R^{75} , R^{76} , R^{77} , R^{78} , R^{79} , R^{80} , R^{81} , R^{82} , R^{83} , R^{84} , R^{85} , R^{86} , R^{87} , R^{88} , R^{89} , R^{90} , R^{91} , R^{92} , R^{93} , R^{94} , R^{95} , R^{96} , R^{97} , R^{98} , R^{99} , R^{100} , R^{101} , R^{102} , R^{103} , R^{104} , R^{105} , R^{106} , R^{107} , R^{108} , R^{109} , R^{110} , R^{111} , R^{112} , R^{113} , R^{114} , R^{115} , R^{116} , R^{117} , R^{118} , R^{119} , R^{120} , R^{121} , R^{122} , R^{123} , R^{124} , R^{125} , R^{126} , R^{127} , R^{128} , R^{129} , R^{130} , R^{131} , R^{132} , R^{133} , R^{134} , R^{135} , R^{136} , R^{137} , R^{138} , R^{139} , R^{140} , R^{141} , R^{142} , R^{143} , R^{144} , R^{145} , R^{146} , R^{147} , R^{148} , R^{149} , R^{150} , R^{151} , R^{152} , R^{153} , R^{154} , R^{155} , R^{156} , R^{157} , R^{158} , R^{159} , R^{160} , R^{161} , R^{162} , R^{163} , R^{164} , R^{165} , R^{166} , R^{167} , R^{168} , R^{169} , R^{170} , R^{171} , R^{172} , R^{173} , R^{174} , R^{175} , R^{176} , R^{177} , R^{178} , R^{179} , R^{180} , R^{181} , R^{182} , R^{183} , R^{184} , R^{185} , R^{186} , R^{187} , R^{188} , R^{189} , R^{190} , R^{191} , R^{192} , R^{193} , R^{194} , R^{195} , R^{196} , R^{197} , R^{198} , R^{199} , R^{200} , R^{201} , R^{202} , R^{203} , R^{204} , R^{205} , R^{206} , R^{207} , R^{208} , R^{209} , R^{210} , R^{211} , R^{212} , R^{213} , R^{214} , R^{215} , R^{216} , R^{217} , R^{218} , R^{219} , R^{220} , R^{221} , R^{222} , R^{223} , R^{224} , R^{225} , R^{226} , R^{227} , R^{228} , R^{229} , R^{230} , R^{231} , R^{232} , R^{233} , R^{234} , R^{235} , R^{236} , R^{237} , R^{238} , R^{239} , R^{240} , R^{241} , R^{242} , R^{243} , R^{244} , R^{245} , R^{246} , R^{247} , R^{248} , R^{249} , R^{250} , R^{251} , R^{252} , R^{253} , R^{254} , R^{255} , R^{256} , R^{257} , R^{258} , R^{259} , R^{260} , R^{261} , R^{262} , R^{263} , R^{264} , R^{265} , R^{266} , R^{267} , R^{268} , R^{269} , R^{270} , R^{271} , R^{272} , R^{273} , R^{274} , R^{275} , R^{276} , R^{277} , R^{278} , R^{279} , R^{280} , R^{281} , R^{282} , R^{283} , R^{284} , R^{285} , R^{286} , R^{287} , R^{288} , R^{289} , R^{290} , R^{291} , R^{292} , R^{293} , R^{294} , R^{295} , R^{296} , R^{297} , R^{298} , R^{299} , R^{300} , R^{301} , R^{302} , R^{303} , R^{304} , R^{305} , R^{306} , R^{307} , R^{308} , R^{309} , R^{310} , R^{311} , R^{312} , R^{313} , R^{314} , R^{315} , R^{316} , R^{317} , R^{318} , R^{319} , R^{320} , R^{321} , R^{322} , R^{323} , R^{324} , R^{325} , R^{326} , R^{327} , R^{328} , R^{329} , R^{330} , R^{331} , R^{332} , R^{333} , R^{334} , R^{335} , R^{336} , R^{337} , R^{338} , R^{339} , R^{340} , R^{341} , R^{342} , R^{343} , R^{344} , R^{345} , R^{346} , R^{347} , R^{348} , R^{349} , R^{350} , R^{351} , R^{352} , R^{353} , R^{354} , R^{355} , R^{356} , R^{357} , R^{358} , R^{359} , R^{360} , R^{361} , R^{362} , R^{363} , R^{364} , R^{365} , R^{366} , R^{367} , R^{368} , R^{369} , R^{370} , R^{371} , R^{372} , R^{373} , R^{374} , R^{375} , R^{376} , R^{377} , R^{378} , R^{379} , R^{380} , R^{381} , R^{382} , R^{383} , R^{384} , R^{385} , R^{386} , R^{387} , R^{388} , R^{389} , R^{390} , R^{391} , R^{392} , R^{393} , R^{394} , R^{395} , R^{396} , R^{397} , R^{398} , R^{399} , R^{400} , R^{401} , R^{402} , R^{403} , R^{404} , R^{405} , R^{406} , R^{407} , R^{408} , R^{409} , R^{410} , R^{411} , R^{412} , R^{413} , R^{414} , R^{415} , R^{416} , R^{417} , R^{418} , R^{419} , R^{420} , R^{421} , R^{422} , R^{423} , R^{424} , R^{425} , R^{426} , R^{427} , R^{428} , R^{429} , R^{430} , R^{431} , R^{432} , R^{433} , R^{434} , R^{435} , R^{436} , R^{437} , R^{438} , R^{439} , R^{440} , R^{441} , R^{442} , R^{443} , R^{444} , R^{445} , R^{446} , R^{447} , R^{448} , R^{449} , R^{450} , R^{451} , R^{452} , R^{453} , R^{454} , R^{455} , R^{456} , R^{457} , R^{458} , R^{459} , R^{460} , R^{461} , R^{462} , R^{463} , R^{464} , R^{465} , R^{466} , R^{467} , R^{468} , R^{469} , R^{470} , R^{471} , R^{472} , R^{473} , R^{474} , R^{475} , R^{476} , R^{477} , R^{478} , R^{479} , R^{480} , R^{481} , R^{482} , R^{483} , R^{484} , R^{485} , R^{486} , R^{487} , R^{488} , R^{489} , R^{490} , R^{491} , R^{492} , R^{493} , R^{494} , R^{495} , R^{496} , R^{497} , R^{498} , R^{499} , R^{500} , R^{501} , R^{502} , R^{503} , R^{504} , R^{505} , R^{506} , R^{507} , R^{508} , R^{509} , R^{510} , R^{511} , R^{512} , R^{513} , R^{514} , R^{515} , R^{516} , R^{517} , R^{518} , R^{519} , R^{520} , R^{521} , R^{522} , R^{523} , R^{524} , R^{525} , R^{526} , R^{527} , R^{528} , R^{529} , R^{530} , R^{531} , R^{532} , R^{533} , R^{534} , R^{535} , R^{536} , R^{537} , R^{538} , R^{539} , R^{540} , R^{541} , R^{542} , R^{543} , R^{544} , R^{545} , R^{546} , R^{547} , R^{548} , R^{549} , R^{550} , R^{551} , R^{552} , R^{553} , R^{554} , R^{555} , R^{556} , R^{557} , R^{558} , R^{559} , R^{560} , R^{561} , R^{562} , R^{563} , R^{564} , R^{565} , R^{566} , R^{567} , R^{568} , R^{569} , R^{570} , R^{571} , R^{572} , R^{573} , R^{574} , R^{575} , R^{576} , R^{577} , R^{578} , R^{579} , R^{580} , R^{581} , R^{582} , R^{583} , R^{584} , R^{585} , R^{586} , R^{587} , R^{588} , R^{589} , R^{590} , R^{591} , R^{592} , R^{593} , R^{594} , R^{595} , R^{596} , R^{597} , R^{598} , R^{599} , R^{600} , R^{601} , R^{602} , R^{603} , R^{604} , R^{605} , R^{606} , R^{607} , R^{608} , R^{609} , R^{610} , R^{611} , R^{612} , R^{613} , R^{614} , R^{615} , R^{616} , R^{617} , R^{618} , R^{619} , R^{620} , R^{621} , R^{622} , R^{623} , R^{624} , R^{625} , R^{626} , R^{627} , R^{628} , R^{629} , R^{630} , R^{631} , R^{632} , R^{633} , R^{634} , R^{635} , R^{636} , R^{637} , R^{638} , R^{639} , R^{640} , R^{641} , R^{642} , R^{643} , R^{644} , R^{645} , R^{646} , R^{647} , R^{648} , R^{649} , R^{650} , R^{651} , R^{652} , R^{653} , R^{654} , R^{655} , R^{656} , R^{657} , R^{658} , R^{659} , R^{660} , R^{661} , R^{662} , R^{663} , R^{664} , R^{665} , R^{666} , R^{667} , R^{668} , R^{669} , R^{670} , R^{671} , R^{672} , R^{673} , R^{674} , R^{675} , R^{676} , R^{677} , R^{678} , R^{679} , R^{680} , R^{681} , R^{682} , R^{683} , R^{684} , R^{685} , R^{686} , R^{687} , R^{688} , R^{689} , R^{690} , R^{691} , R^{692} , R^{693} , R^{694} , R^{695} , R^{696} , R^{697} , R^{698} , R^{699} , R^{700} , R^{701} , R^{702} , R^{703} , R^{704} , R^{705} , R^{706} , R^{707} , R^{708} , R^{709} , R^{710} , R^{711} , R^{712} , R^{713} , R^{714} , R^{715} , R^{716} , R^{717} , R^{718} , R^{719} , R^{720} , R^{721} , R^{722} , R^{723} , R^{724} , R^{725} , R^{726} , R^{727} , R^{728} , R^{729} , R^{730} , R^{731} , R^{732} , R^{733} , R^{734} , R^{735} , R^{736} , R^{737} , R^{738} , R^{739} , R^{740} , R^{741} , R^{742} , R^{743} , R^{744} , R^{745} , R^{746} , R^{747} , R^{748} , R^{749} , R^{750} , R^{751} , R^{752} , R^{753} , R^{754} , R^{755} , R^{756} , R^{757} , R^{758} , R^{759} , R^{760} , R^{761} , R^{762} , R^{763} , R^{764} , R^{765} , R^{766} , R^{767} , R^{768} , R^{769} , R^{770} , R^{771} , R^{772} , R^{773} , R^{774} , R^{775} , R^{776} , R^{777} , R^{778} , R^{779} , R^{780} , R^{781} , R^{782} , R^{783} , R^{784} , R^{785} , R^{786} , R^{787} , R^{788} , R^{789} , R^{790} , R^{791} , R^{792} , R^{793} , R^{794} , R^{795} , R^{796} , R^{797} , R^{798} , R^{799} , R^{800} , R^{801} , R^{802} , R^{803} , R^{804} , R^{805} , R^{806} , R^{807} , R^{808} , R^{809} , R^{810} , R^{811} , R^{812} , R^{813} , R^{814} , R^{815} , R^{816} , R^{817} , R^{818} , R^{819} , R^{820} , R^{821} , R^{822} , R^{823} , R^{824} , R^{825} , R^{826} , R^{827} , R^{828} , R^{829} , R^{830} , R^{831} , R^{832} , R^{833} , R^{834} , R^{835} , R^{836} , R^{837} , R^{838} , R^{839} , R^{840} , R^{841} , R^{842} , R^{843} , R^{844} , R^{845} , R^{846} , R^{847} , R^{848} , R^{849} , R^{850} , R^{851} , R^{852} , R^{853} , R^{854} , R^{855} , R^{856} , R^{857} , R^{858} , R^{859} , R^{860} , R^{861} , R^{862} , R^{863} , R^{864} , R^{865} , R^{866} , R^{867} , R^{868} , R^{869} , R^{870} , R^{871} , R^{872} , R^{873} , R^{874} , R^{875} , R^{876} , R^{877} , R^{878} , R^{879} , R^{880} , R^{881} , R^{882} , R^{883} , R^{884} , R^{885} , R^{886} , R^{887} , R^{888} , R^{889} , R^{890} , R^{891} , R^{892} , R^{893} , R^{894} , R^{895} , R^{896} , R^{897} , R^{898} , R^{899} , R^{900} , R^{901} , R^{902} , R^{903} , R^{904} , R^{905} , R^{906} , R^{907} , R^{908} , R^{909} , R^{910} , R^{911} , R^{912} , R^{913} , R^{914} , R^{915} , R^{916} , R^{917} , R^{918} , R^{919} , R^{920} , R^{921} , R^{922} , R^{923} , R^{924} , R^{925} , R^{926} , R^{927} , R^{928} , R^{929} , R^{930} , R^{931} , R^{932} , R^{933} , R^{934} , R^{935} , R^{936} , R^{937} , R^{938} , R^{939} , R^{940} , R^{941} , R^{942} , R^{943} , R^{944} , R^{945} , R^{946} , R^{947} , R^{948} , R^{949} , R^{950} , R^{951} , R^{952} , R^{953} , R^{954} , R^{955} , R^{956} , R^{957} , R^{958} , R^{959} , R^{960} , R^{961} , R^{962} , R^{963} , R^{964} , R^{965} , R^{966} , R^{967} , R^{968} , R^{969} , R^{970} , R^{971} , R^{972} , R^{973} , R^{974} , R^{975} , R^{976} , R^{977} , R^{978} , R^{979} , R^{980} , R^{981} , R^{982} , R^{983} , R^{984} , R^{985} , R^{986} , R^{987} , R^{988} , R^{989} , R^{990} , R^{991} , R^{992} , R^{993} , R^{994} , R^{995} , R^{996} , R^{997} , R^{998} , R^{999} , R^{1000} , n_1 , n_2 , n_3 y/o n_4 , p. ej., en particular anteriormente en la presente. Algunas preferencias particulares para algunas de estas variables se indican a continuación.

- 30 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{11} es alquilo C_3 - C_5 (en particular *tert*-butilo), cicloalquilo C_4 - C_6 (en particular ciclohexilo) o tetrahidrofuranilo (tal como tetrahidrofuran-3-ilo o tetrahidrofuran-2-ilo), o es una de las subfórmulas A, B, C, D, E, F, G, H, J, K, L, M, N, O, P, Q, R, S, T o U, tal como se han definido en la presente. Como alternativa, preferentemente, R^{11} es una de las subfórmulas V, W, X, Y o Z tal como se han definido en la presente.

- 35 Más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{11} es alquilo C_3 - C_5 (en particular *tert*-butilo) o es una de las subfórmulas A, E, F, G, K, L, M, N, P o Q, tal como se han definido en la presente. Como alternativa, además más preferentemente, R^{11} es la subfórmula V o Y tal como se ha definido en la presente.

- 40 Incluso más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{11} es una de las subfórmulas A, E, F, G, K, M o N, tal como se han definido en la presente. Como alternativa, además incluso más preferentemente, R^{11} es la subfórmula P o Y tal como se ha definido en la presente.

Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{11} es una de las subfórmulas A, E, F o G, tal como se han definido en la presente. Como alternativa, además aún más preferentemente, R^{11} es una de las subfórmulas M, P o Y tal como

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, X^A es CR^{13} , y/o Y^A es CR^{14} y/o Z^A es CR^{15} . En particular preferentemente (especialmente en la realización más preferida de R^{11} en la que es la subfórmula A), X^A es CR^{13} , Y^A es CR^{14} y Z^A es CR^{15} .

Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención:

- 5 Cuando R^{11} es la subfórmula B, entonces es la subfórmula B1 tal como se ha definido en la presente; y/o cuando R^{11} es la subfórmula D, entonces es la subfórmula D1 tal como se ha definido en la presente; y/o cuando R^{11} es la subfórmula G, entonces es la subfórmula G1 tal como se ha definido en la presente; y/o cuando R^{11} es la subfórmula P, entonces es la subfórmula P1 tal como se ha definido en la presente.

- 10 Preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, cuando R^{13} es bromo, entonces X^A es CR^{13} , Y^A es CR^{14} , Z^A es CR^{15} , y R^{12} , R^{14} y R^{15} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno. Más preferentemente, en este caso, todos los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} son hidrógeno.

En particular preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención,

R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

- 15 R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ; (incluso más preferentemente, R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi));

R^{14} es hidrógeno, flúor o cloro; y

R^{15} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo; (incluso más preferentemente, R^{15} es hidrógeno, flúor o cloro);

- 20 siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos, preferentemente tres o todos) de los grupos R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{13} sea bromo, entonces R^{12} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno.

En esta realización preferida en particular, preferentemente:

R^{11} es la subfórmula A; y/o

- 25 X^A es CR^{13} , Y^A es CR^{14} y Z^A es CR^{15} .

Incluso más en particular preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{12} , R^{14} y R^{15} son todos hidrógeno, y

R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalcoxi C_1 (p. ej., difluorometoxi o trifluorometoxi).

En esta realización incluso más particularmente preferida, preferentemente:

- 30 R^{11} es la subfórmula A; y/o

X^A es CR^{13} , Y^A es CR^{14} y Z^A es CR^{15} .

Aún más en particular preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{12} , R^{14} y R^{15} son todos hidrógeno, y

R^{13} es hidrógeno, bromo o fluoroalcoxi C_1 (en particular hidrógeno, bromo, difluorometoxi o trifluorometoxi).

- 35 En esta realización aún más particularmente preferida, preferentemente:

R^{11} es la subfórmula A; y/o

X^A es CR^{13} , Y^A es CR^{14} y Z^A es CR^{15} .

- 40 Aún más preferentemente, p. ej., en todos los aspectos y/o realizaciones de la invención, R^{12} es hidrógeno, y/o R^{13} es hidrógeno, y/o R^{14} es hidrógeno, y/o R^{15} es hidrógeno. Aún más preferentemente, R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} son todos hidrógeno.

En estas realizaciones más preferidas, preferentemente:

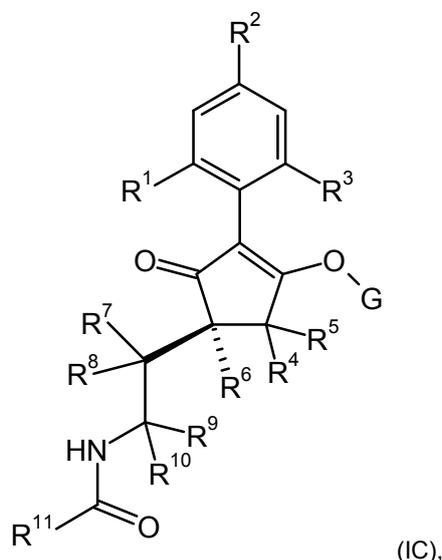
R^{11} es la subfórmula A; y/o

X^A es CR^{13} , Y^A es CR^{14} y Z^A es CR^{15} .

En una realización más particularmente preferida de la invención (que, p. ej., se puede aplicar a todos los aspectos y/o realizaciones de la invención), el compuesto de fórmula (I) es cualquiera de (p. ej., uno cualquiera de) los compuestos A1-A99, o el compuesto A100 o A101, o cualquiera de (p. ej., uno cualquiera de) los compuestos A102-A108, tal como se han descrito y/o ilustrado en la presente, presente en forma de un compuesto libre (es decir, un compuesto que no se encuentra sustancialmente en forma de una sal) y/o (p. ej., cuando sea químicamente posible) presente como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

En otra realización preferida de la invención (que, p. ej., se puede aplicar a todos los aspectos y/o realizaciones de la invención), el compuesto de fórmula (I) es cualquiera de (p. ej., uno cualquiera de) los compuestos A109-A211 o cualquiera de (p. ej., uno cualquiera de) los compuestos P1-P30, tal como se describen y/o ilustran en la presente, presente en forma de un compuesto libre (es decir, un compuesto que no se encuentra sustancialmente en forma de una sal) y/o (p. ej., cuando sea químicamente posible) presente como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

En todas las realizaciones o aspectos de la invención, es sumamente preferible que el compuesto de fórmula (I) sea un compuesto de fórmula (IC):



donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} y G son como se ha descrito en la presente,

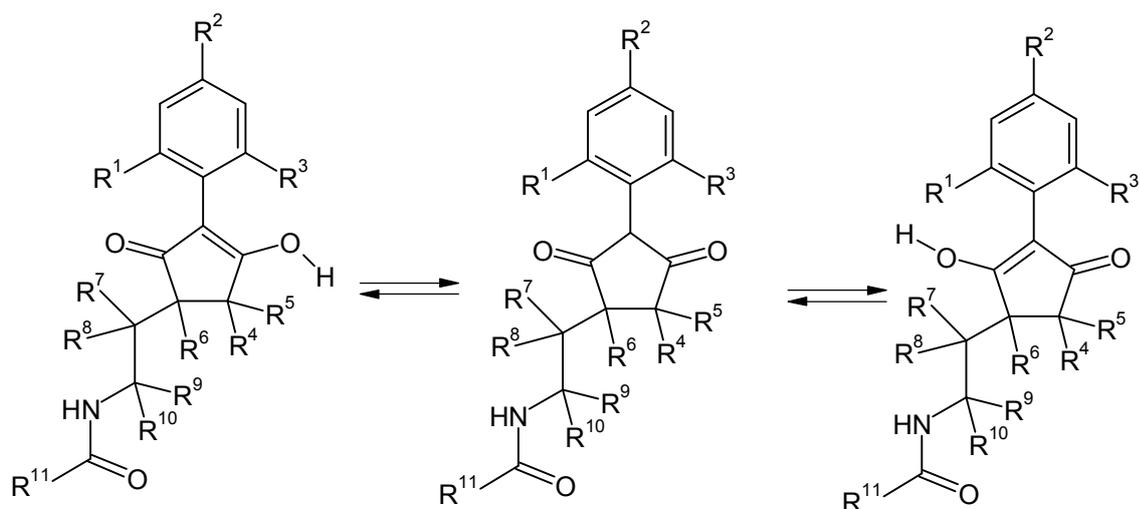
y donde un porcentaje mayor o igual al 40% (en particular mayor o igual al 45%) en molaridad del compuesto de fórmula (IC) tiene la estereoquímica indicada en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$. Por ejemplo, esta definición más amplia de la fórmula (IC) incluye compuestos que son sustancialmente racémicos en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$, y también incluye compuestos enriquecidos en uno o más isómeros que tienen la estereoquímica indicada en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$.

Más preferentemente, un porcentaje superior al 50% (aún más preferentemente superior al 70% o superior al 80%, aún más preferentemente superior al 90% o superior al 95%) en molaridad del compuesto de fórmula (IC) tiene la estereoquímica indicada en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$. Esta definición más preferida de la fórmula (IC) incluye compuestos enriquecidos en uno o más isómeros que tienen la estereoquímica indicada en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$.

Sobre la base de los resultados biológicos que se muestran en la presente (remítase al Ejemplo biológico 1B de la presente, comparando los resultados de los enantiómeros separados en una columna quiral: los compuestos A98 y A99, y los compuestos A100 y A101), se cree que los compuestos con la estereoquímica indicada en la fórmula (IC) (tales como, por ejemplo, el compuesto A98 o A100) normalmente tienen una actividad herbicida más potente contra malezas monocotiledóneas herbáceas (p. ej., cuando se aplica después de la emergencia a las malezas) que los compuestos con la estereoquímica opuesta (tal como, por ejemplo, el compuesto A99 o A101).

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes G, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} y R^{11} , los compuestos de fórmula (I) pueden existir en formas tautoméricas o isoméricas diferentes.

Por ejemplo, cuando G es hidrógeno, los compuestos de fórmula (I) pueden existir en formas tautoméricas diferentes, como las que se describen a continuación:



Asimismo, cuando los sustituyentes contienen dobles enlaces, pueden existir isómeros *cis* y *trans*.

Esta invención abarca todos estos isómeros y/o tautómeros, y/o sus mezclas en todas las proporciones. Estos isómeros y/o tautómeros se encuentran a su vez dentro del alcance de los compuestos de fórmula (I) reivindicados.

5 Procesos para preparar los compuestos, p. ej., los compuestos de fórmula (I)

Los procesos para preparar los compuestos, p. ej., un compuesto de fórmula (I) (que puede ser opcionalmente una de sus sales agroquímicamente aceptables), se describen a continuación y constituyen aspectos adicionales de la presente invención.

Un compuesto de fórmula I, donde G es:

- 10 $-C(X^a)-R^a$, $-C(X^b)-X^c-R^b$, $-C(X^d)-N(R^c)-R^d$, $-SO_2-R^e$, $-P(X^e)(R^f)-R^g$, $-CH_2-X^f-R^h$, $-CH(Me)-X^f-R^h$; o fenil- CH_2 - o fenil- CH (alquil C_1-C_2)- (en cada uno de los cuales el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1-C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o heteroaril- CH_2 - o heteroaril- CH (alquil C_1-C_2)- (en cada uno de los cuales el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1-C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o fenil- $C(O)-CH_2$ - (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1-C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro); o (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)-CH_2$ -, (alquil C_1-C_6)- $C(O)-CH_2$ -, (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)-CH=CH$ -, (alquen C_2-C_7)-1-il- CH_2 -, (alquen C_2-C_7)-1-il- CH (alquil C_1-C_2)-, (fluoroalquen C_2-C_4)-1-il- CH_2 -, (alquin C_2-C_7)-1-il- CH_2 - o (alquin C_2-C_7)-1-il- CH (alquil C_1-C_2)-;

se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (A), que es un compuesto de fórmula I donde G es H,

- 20 (a) con un reactivo G1-Z, donde G1-Z es un agente alquilante (donde G1 es un grupo orgánico de acuerdo con G dentro del compuesto de fórmula (I) y que está enlazado a través de un átomo de carbono que no sea carbonílico ni tiocarbonílico) tal como un haluro orgánico (en el que Z = halógeno tal como cloro, bromo o yodo); donde el haluro orgánico (p. ej., cloruro) puede ser normalmente un haluro de alquilo sustituido (p. ej., cloruro) tal como un éter alquil clorometílico $Cl-CH_2-X^f-R^h$, donde X^f es oxígeno, un sulfuro alquilico de clorometilo $Cl-CH_2-X^f-R^h$, donde X^f es azufre, un haluro de bencilo opcionalmente sustituido adecuado (p. ej., cloruro) tal como $Cl-CH_2$ -[fenilo opcionalmente sustituido], [fenil opcionalmente sustituido]- $C(O)-CH_2$ -[halógeno, p. ej., Cl], (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)-CH_2$ -[halógeno, p. ej., Cl], (alquil C_1-C_6)- $C(O)-CH_2$ -[halógeno, p. ej., Cl], (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)-CH=CH$ -[halógeno, p. ej., Cl], un haluro de alqueno o alquino adecuado (p. ej., cloruro) tal como (alquen C_2-C_7)-1-il- CH_2 -[halógeno, p. ej., Cl] o (alquin C_2-C_7)-1-il- CH_2 -[halógeno, p. ej., Cl], u otro haluro orgánico adecuado para preparar un grupo G (o G1) enlazado a través de carbono no carbonílico ni tiocarbonílico; o

- 35 (b) [p. ej., para preparar grupos G unidos a través de carbono carbonílico o grupos unidos a través de carbono tiocarbonílico] con un agente acilante tal como un ácido carboxílico $HO-C(X^a)R^a$, donde X^a es oxígeno, un cloruro de acilo $Cl-C(X^a)R^a$, donde X^a es oxígeno, o un anhídrido de ácido $[R^aC(X^a)]_2O$, donde X^a es oxígeno, o un isocianato $R^cN=C=O$, o un cloruro de carbamoilo $Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d$ (donde X^d es oxígeno y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloruro de tiocarbamoilo $Cl-(X^d)-N(R^c)-R^d$ (donde X^d es azufre y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloroformiato $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$ (donde X^b y X^c son oxígeno), o un clorotioformiato $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$ (donde X^b y X^c son azufre), o un isotiocianato $R^cN=C=S$; o

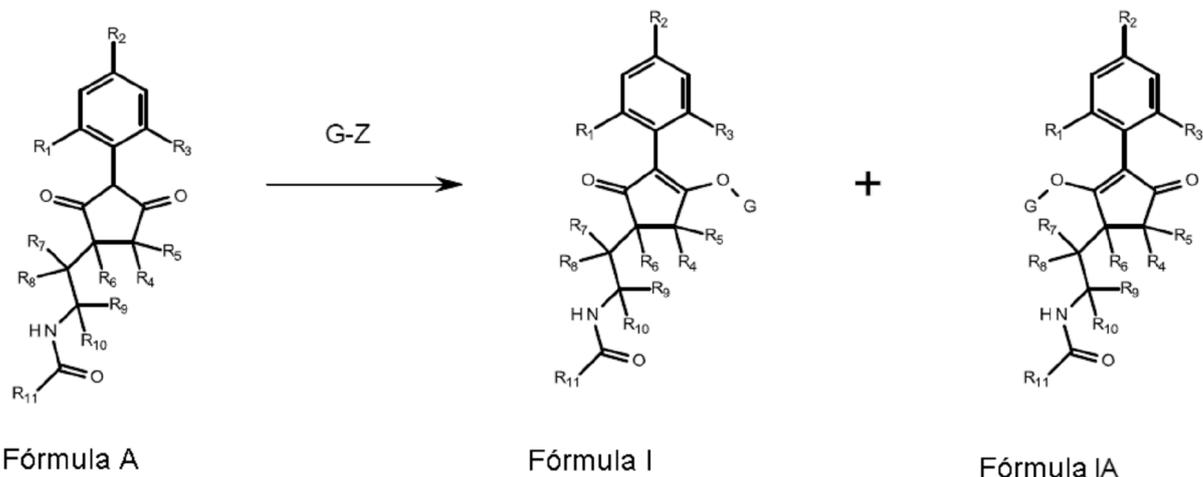
(c) por tratamiento secuencial con disulfuro de carbono y un agente alquilante; o

(d) con un agente fosforilante tal como un cloruro de fosforilo $\text{Cl-P}(\text{X}^e)(\text{R}^f)\text{-R}^g$; o

(e) con un agente sulfonilante tal como un cloruro de sulfonilo $\text{Cl-SO}_2\text{-R}^e$, preferentemente en presencia de al menos un equivalente de base.

5 Cuando los sustituyentes R^4 y R^5 no son iguales a los sustituyentes R^6 y $\text{-CR}^7\text{R}^8\text{-CR}^9\text{R}^{10}\text{-NHC(O)-R}^{11}$, las reacciones descritas anteriormente pueden producir, además de un compuesto de fórmula (I), un segundo compuesto de fórmula (IA) (véase a continuación).

La presente invención abarca tanto un compuesto de fórmula (I) como un compuesto de fórmula (IA), ya sea (I) solo o (IA) solo o como una mezcla de compuestos (I) y (IA) en cualquier proporción.



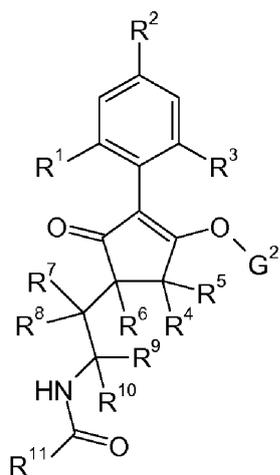
10 La O-alkilación de 1,3-dionas cíclicas es conocida; se describen métodos adecuados, por ejemplo, en el documento US4436666 de T. Wheeler. Se han descrito procedimientos alternativos en los artículos de M. Pizzorno y S. Albonico, *Chem. Ind.* (Londres), (1972), 425-426; H. Born *et al.*, *J. Chem. Soc.*, (1953), 1779-1782; M. G. Constantino *et al.*, *Synth. Commun.*, (1992), 22 (19), 2859-2864; Y. Tian *et al.*, *Synth. Commun.*, (1997), 27 (9), 1577-1582; S. Chandra Roy *et al.*, *Chem. Letters*, (2006), 35 (1), 16-17; P. K. Zubaidha *et al.*, *Tetrahedron Lett.*, (2004), 45, 7187-7188.

La O-acilación de 1,3-dionas cíclicas puede llevarse a cabo, p. ej., mediante procedimientos similares a los descritos, p. ej., por R. Haines en US4175135 y por T. Wheeler en US4422870, US4659372 y US4436666. Normalmente las dionas de fórmula (A) se pueden tratar con un agente acilante preferentemente en presencia de al menos un equivalente de una base adecuada y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado. La base puede ser inorgánica, tal como un hidróxido o carbonato de un metal alcalino, o un hidruro metálico, o una base orgánica tal como una amina terciaria o alcóxido metálico. Los ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, hidróxido de sodio o potasio, o hidruro sódico, y las bases orgánicas adecuadas incluyen trietilaminas, tales como trimetilamina o trietilamina, piridinas u otras bases aminicas tales como 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los disolventes adecuados para esta reacción se seleccionan de modo que sean compatibles con los reactivos e incluyen éteres, tales como tetrahydrofurano o 1,2-dimetoxietano, o disolventes halogenados tales como diclorometano o cloroformo. Se pueden emplear ciertas bases, tales como piridina o trietilamina, con éxito tanto como base como disolvente. En los casos en los que el agente acilante sea un ácido carboxílico, la acilación se lleva a cabo preferentemente en presencia de un agente de acoplamiento conocido, tal como yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida o *N,N'*-carbodiimidazol, y opcionalmente en presencia de una base, tal como trietilamina o piridina, en un disolvente adecuado tal como tetrahydrofurano, diclorometano o acetonitrilo. Se describen procedimientos adecuados, p. ej., en los artículos de W. Zhang y G. Pugh, *Tetrahedron Lett.*, (1999), 40 (43), 7595-7598; T. Isobe y T. Ishikawa, *J. Org. Chem.*, (1999), 64 (19), 6984-6988 y K. Nicolaou, T. Montagnon, G. Vassilikogiannakis, C. Mathison, *J. Am. Chem. Soc.*, (2005), 127(24), 8872-8888.

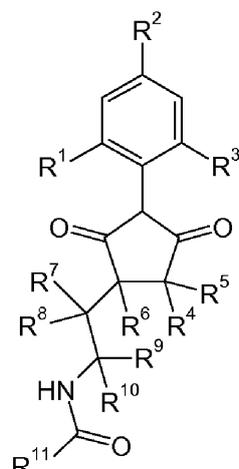
35 La fosforilación de 1,3-dionas cíclicas puede llevarse a cabo, p. ej., utilizando un haluro de fosforilo o haluro de tiofosforilo y una base, p. ej., mediante procedimientos análogos a los descritos por L. Hodakowski en el documento US4409153.

La sulfonilación de un compuesto de fórmula (A) puede conseguirse, p. ej., utilizando un haluro de alquil- o arilsulfonilo, preferentemente en presencia de al menos un equivalente de base, por ejemplo, mediante el procedimiento de C. Kowalski y K. Fields, *J. Org. Chem.*, (1981), 46, 197-201.

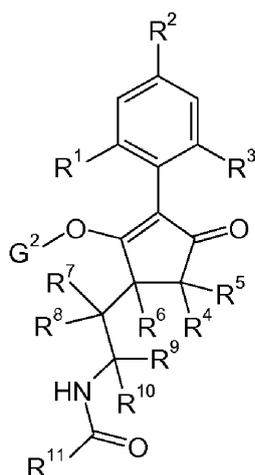
40



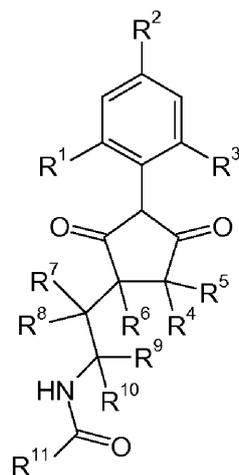
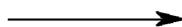
Fórmula IB



Fórmula A

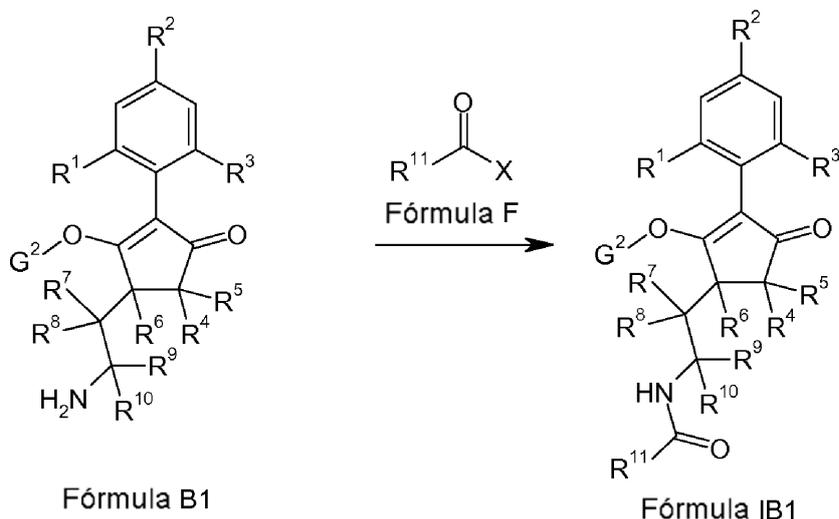
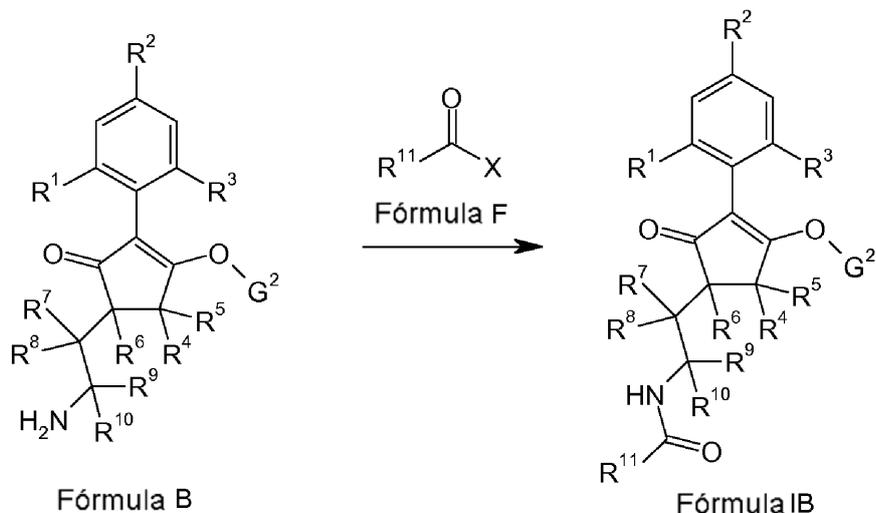


Fórmula IB1



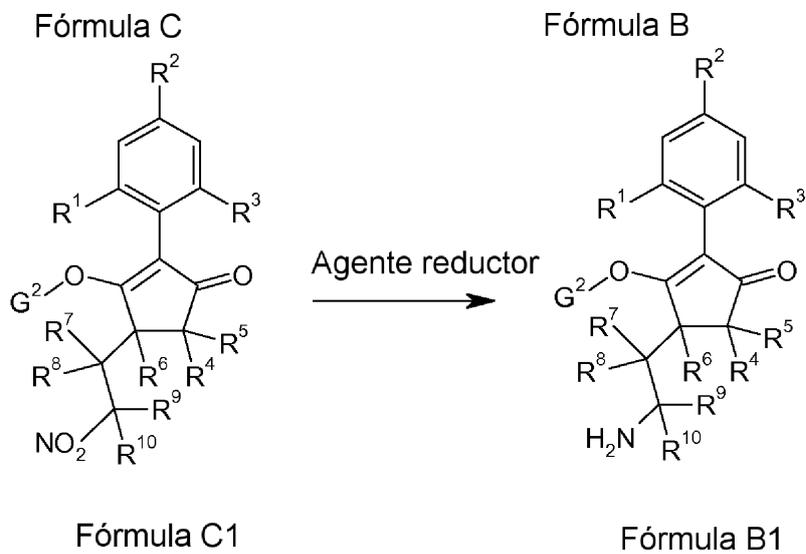
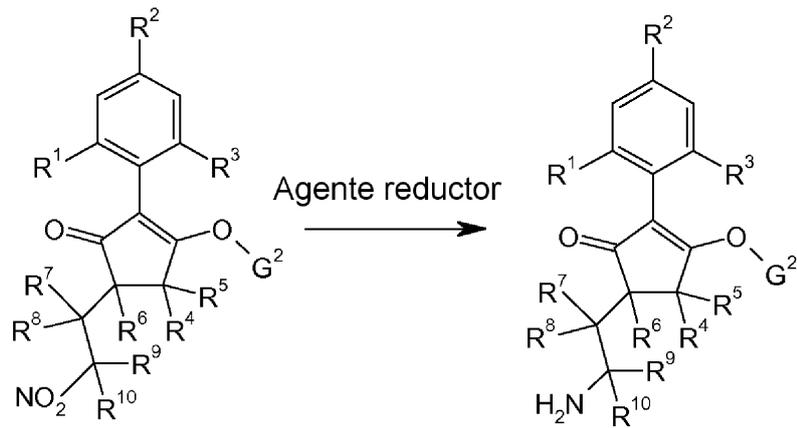
Fórmula A

- Un compuesto de Fórmula A se puede preparar mediante la desprotección de un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde G^2 es habitualmente alquilo C_1-C_6 , $-C(O)O$ (alquilo C_1-C_6), $-C(O)NH$ (alquilo C_1-C_6) o $-C(O)N$ (alquilo C_1-C_6)₂, p. ej., como se ha mostrado
- 5 anteriormente. La desprotección se lleva a cabo normalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., un disolvente acuoso o un disolvente orgánico, p. ej., un disolvente orgánico no acuoso, y/o una mezcla de disolventes acuosos y/u orgánicos), en presencia de una base adecuada y/o un ácido adecuado. La desprotección se lleva a cabo normalmente a temperatura ambiente o se calienta térmicamente o con irradiación de microondas. Los disolventes adecuados incluyen *N,N*-dimetilformamida, acetona, tetrahidrofurano, agua o diclorometano o mezclas
- 10 de estos. Las bases adecuadas incluyen bases orgánicas o inorgánicas tales como un hidróxido de un metal o aminas terciarias tales como morfolina. Los ácidos adecuados incluyen ácidos acuosos u orgánicos tales como el ácido trifluoroacético, ácido 4-metilbencenosulfónico (p-TSA, ácido *para*-toluenosulfónico), ácido triflico (ácido trifluorometanosulfónico) o ácido clorhídrico.



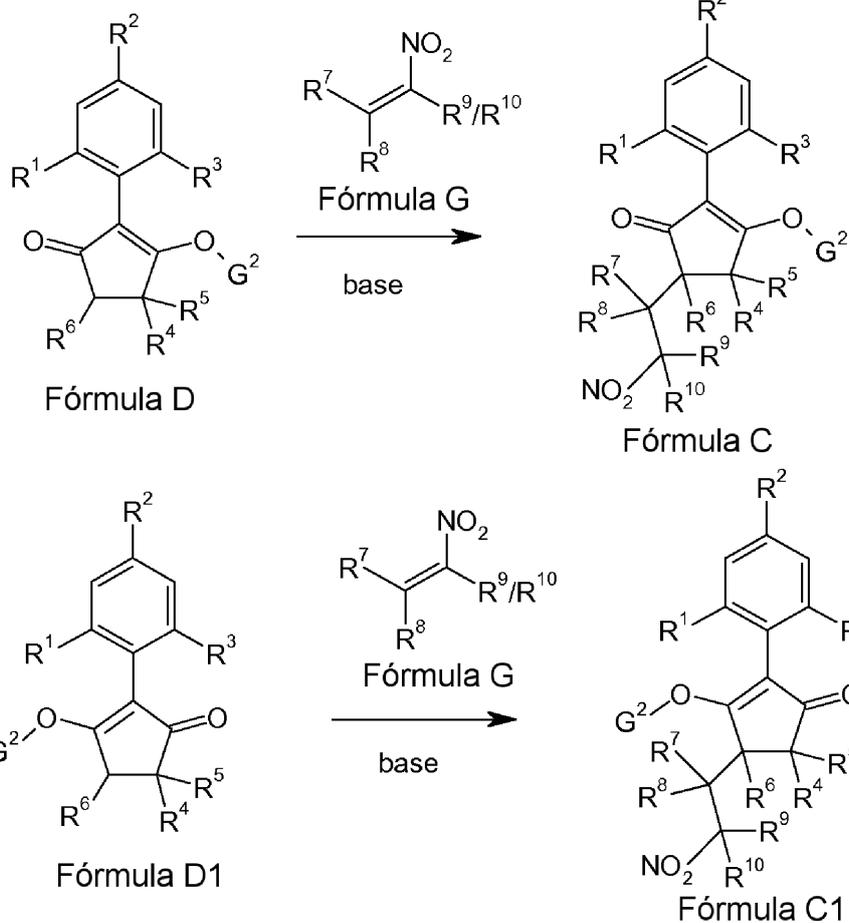
Un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde G² es habitualmente alquilo C₁-C₆, -C(O)O(alquilo C₁-C₆), -C(O)NH-(alquilo C₁-C₆) o -C(O)N(alquilo C₁-C₆)₂, se puede preparar mediante una reacción de formación de un enlace amídico entre un compuesto de Fórmula B o B1, respectivamente, y un compuesto de Fórmula F, donde X = halógeno, OH u OR (siendo OR un grupo saliente enlazado a través del oxígeno, p. ej., pentafluorofenoxi o, p. ej., un sulfonato de alquilo, fluoroalquilo o arilo tal como metanosulfonato, trifluorometanosulfonato o para-toluenosulfonato), p. ej., como se ha mostrado anteriormente. La reacción de formación del enlace amídico se lleva a cabo habitualmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., un disolvente orgánico y/o no acuoso) y/o en presencia de un reactivo de acoplamiento adecuado, y/o en presencia de una base adecuada. Los disolventes adecuados incluyen *N,N*-dimetilformamida o diclorometano. Los reactivos de acoplamiento adecuados incluyen una carbodiimida (p. ej., dicitlohexilcarbodiimida, "DCC") o un anhídrido fosfónico (p. ej., 2,4,6-tripropil-1,3,5,2,4,6-trioxatрифосфоринан-2,4,6-trióxido) o una sal de (benzotriazol-1-iloxi)trialquilaminofosfonio (p. ej., hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxi(tripirrolidin-1-il)fosfonio). Las bases adecuadas incluyen bases orgánicas no acuosas tales como aminas terciarias como, por ejemplo, *N,N*-diisopropiletilamina o trietilamina.

Los compuestos de Fórmula F se pueden preparar mediante métodos conocidos.



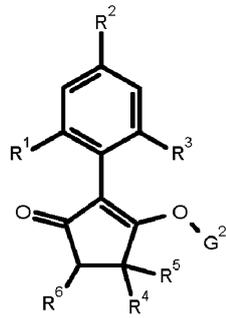
Los compuestos de Fórmula B o B1 se pueden preparar mediante la reducción de compuestos de Fórmula C o C1 respectivamente en presencia de un agente reductor adecuado, opcionalmente en un disolvente adecuado (p. ej., orgánico) y/o en presencia de un catalizador adecuado, p. ej., como se ha mostrado anteriormente.

- 5 Los agentes reductores adecuados incluyen formiato de amonio (remítase a, por ejemplo, R. Ballini, F. Papa, C. Abate, *European Journal of Organic Chemistry*, 1, 87-90, 1999) o zinc en polvo. Los disolventes adecuados incluyen metanol o ácido acético. Los catalizadores adecuados incluyen paladio sobre carbón.

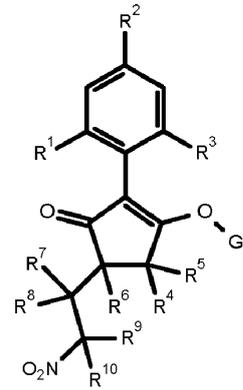
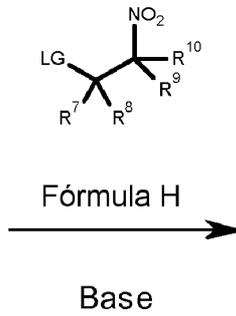


Los compuestos de Fórmula C o C1 (donde, normalmente, al menos uno de los grupos R⁹ y R¹⁰ es hidrógeno) se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de Fórmula D o D1 respectivamente con un compuesto de Fórmula G, que tiene la estructura o fórmula (R⁷)(R⁸)C=C(NO₂)(R⁹ o R¹⁰), en presencia de una base adecuada, normalmente a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico), p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Las bases adecuadas incluyen bases orgánicas y/o no acuosas, en particular bases orgánicas y/o no acuosas fuertes, tales como diisopropilamida de litio (remítase a, por ejemplo, T.J. Dickerson, T. Lovell, M.M. Meijler, L. Noodleman, K.D. Janda, *Journal of Organic Chemistry*, (2004) 69(20), 6603-6609) o bis(trimetilsilil)amida de potasio. Las temperaturas adecuadas varían entre -100 °C y 0 °C. Los disolventes adecuados incluyen tetrahidrofurano.

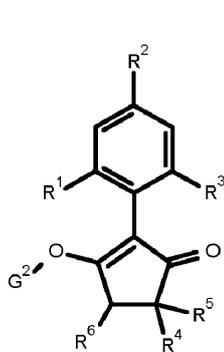
Los compuestos de Fórmula G se pueden preparar mediante métodos conocidos.



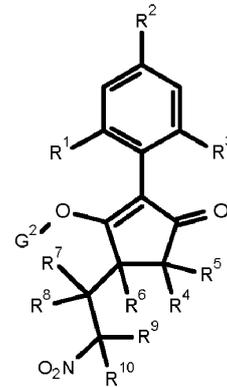
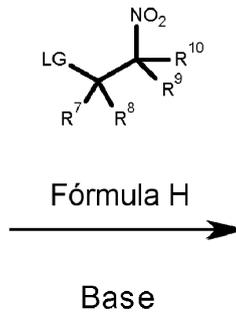
Fórmula D



Fórmula C



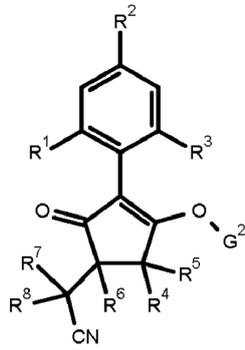
Fórmula D1



Fórmula C1

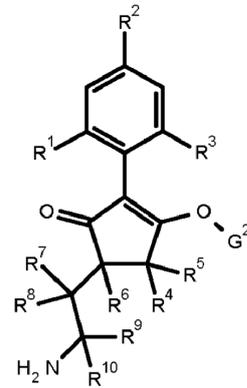
5 En un método alternativo, los compuestos de Fórmula C o C1 se pueden preparar alquilando un compuesto de Fórmula D o D1 respectivamente con un compuesto de Fórmula H, donde LG es un grupo saliente adecuado (tal como un halógeno, p. ej., Cl o Br, o trifluorometanosulfonato o acetato), en presencia de una base adecuada a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamida de litio. Los disolventes adecuados incluyen tetrahidrofurano. Las temperaturas adecuadas varían entre -100 °C y 0 °C.

Los compuestos de Fórmula H se pueden preparar mediante métodos conocidos.

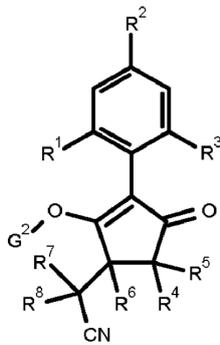


Fórmula E

Agente reductor
 \longrightarrow

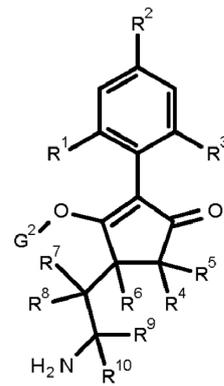


Fórmula B



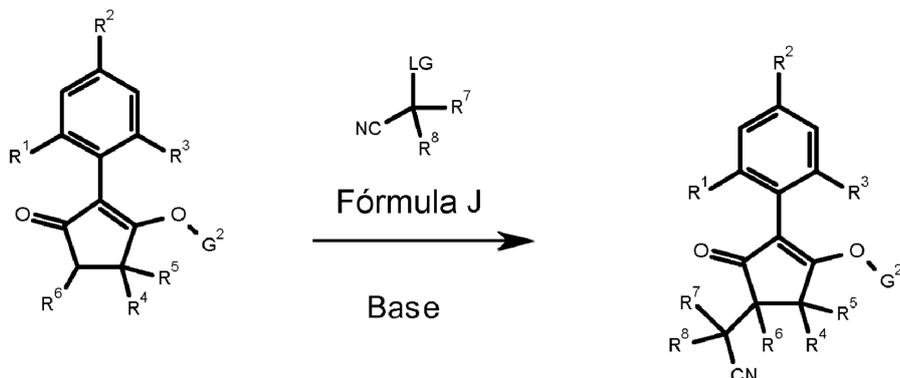
Fórmula E1

Agente reductor
 \longrightarrow



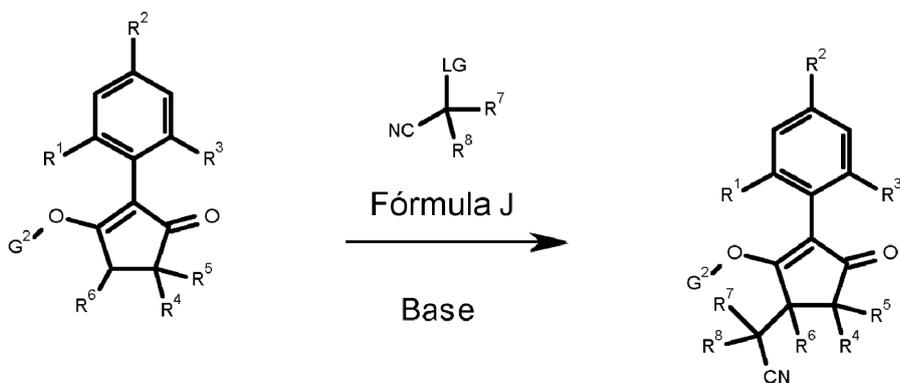
Fórmula B1

5 En otro método alternativo, los compuestos de Fórmula B o B1 se pueden preparar mediante la reducción de compuestos de Fórmula E o E1 respectivamente en presencia de un agente reductor adecuado, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico) y/o en presencia de un catalizador adecuado, p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Los agentes reductores adecuados incluyen hidrógeno gaseoso y los disolventes adecuados incluyen metanol, tetrahidrofurano o 1,4-dioxano. Los catalizadores adecuados incluyen níquel Raney® (remítase a, por ejemplo, C. Jellimann, M. Mathe-Allainmat, J. Andrieux, S. Kloubert, J.A. Boutin, J-P. Nicolas, C. Bennejean, P. Delagrance, M. Langlois, *Journal of Medicinal Chemistry*, (2000), 43(22), 4051-4062).



Fórmula D

Fórmula E

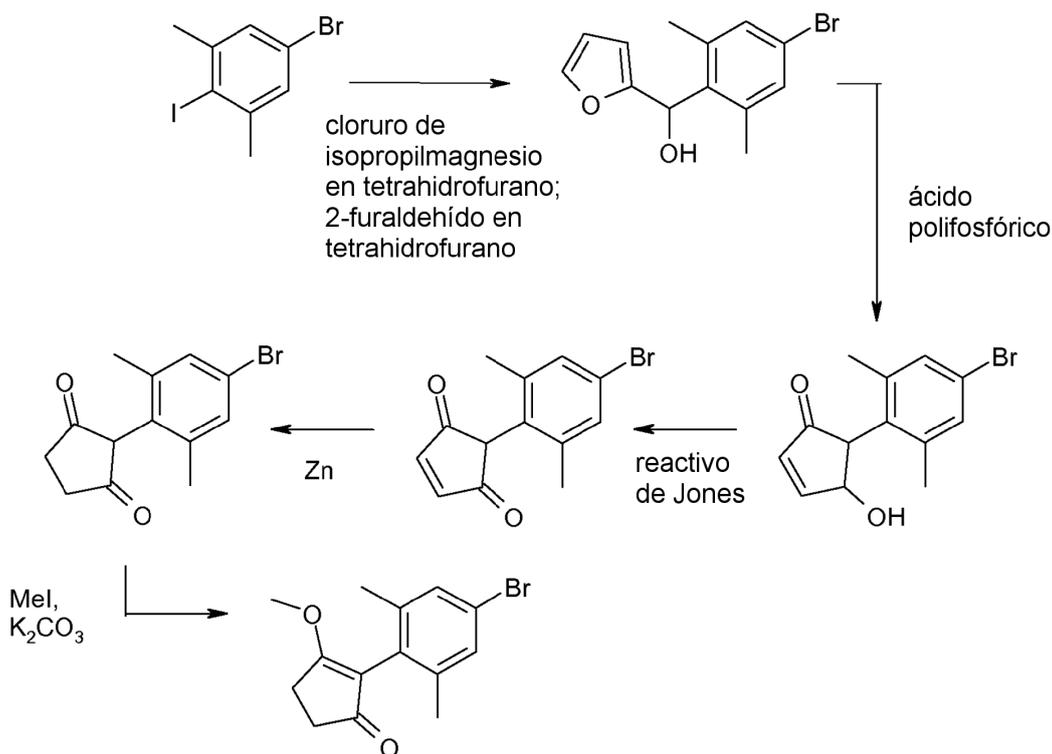


Fórmula D1

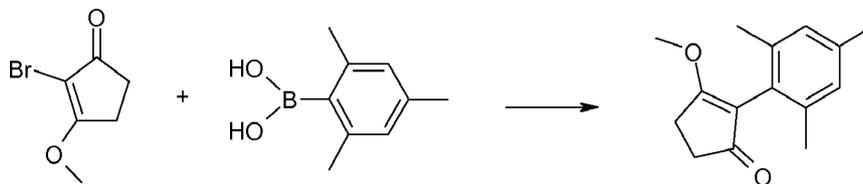
Fórmula E1

- 5 Los compuestos de Fórmula E o E1 se pueden preparar alquilando un compuesto de Fórmula D o D1 respectivamente con un compuesto de Fórmula J (donde LG es un grupo saliente adecuado, tal como un halógeno, p. ej., Cl o Br, o tal como un sulfonato de alquilo, fluoroalquilo o arilo, p. ej., metanosulfonato, trifluorometanosulfonato o para-toluenosulfonato), en presencia de una base adecuada, normalmente a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico y/o no acuoso), p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamida de litio (LDA) (remítase a, por ejemplo, R. Goswami, M.G. Moloney, *Chemical Communications*, (1999) 23, 2333-2334). Los disolventes adecuados incluyen tetrahidrofurano. Las temperaturas adecuadas varían entre -100 °C y 0 °C.
- 10 Los compuestos de Fórmula J se pueden preparar mediante métodos conocidos.

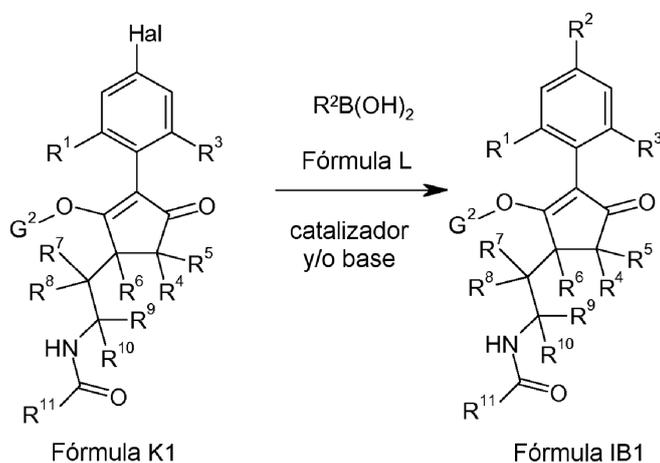
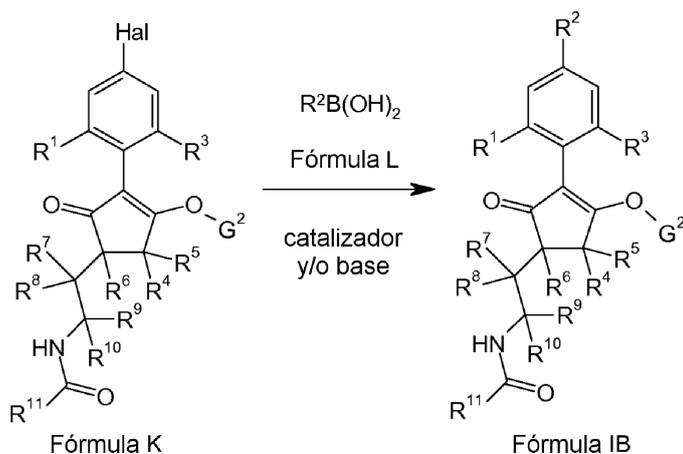
En una realización, los compuestos de fórmula D o D1 se preparan utilizando los procesos descritos detalladamente en el Intermedio 2 posteriormente en la presente (estos son compuestos en los que R² es Br, R¹ y R³ son Me; R⁴, R⁵ y R⁶ son H; y G² es Me). El esquema de reacción para estos procesos del Intermedio 2 se muestra a continuación (y se ilustra para los compuestos de Fórmula D o D1 donde R² es Br, R¹ y R³ son Me; R⁴, R⁵ y R⁶ son H; y G² es Me):



5 En una realización alternativa, los compuestos de fórmula D o D1 se preparan mediante el siguiente esquema de un proceso de acoplamiento, según se describe en el Ejemplo 1 paso 1 en las páginas 54-55 del documento WO 2010/000773 A1 (Syngenta Limited) (que se presenta de nuevo como Intermedio 1 en la presente) y/o según se describe en el documento WO 2010/069834 A1 y/o WO 2011/073060 A2 (ambos de Syngenta Limited y Syngenta Participations AG). El siguiente esquema de un proceso de acoplamiento se ilustra para los compuestos de Fórmula D o D1 donde R¹, R² y R³ son Me; R⁴, R⁵ y R⁶ son H; y G² es Me:

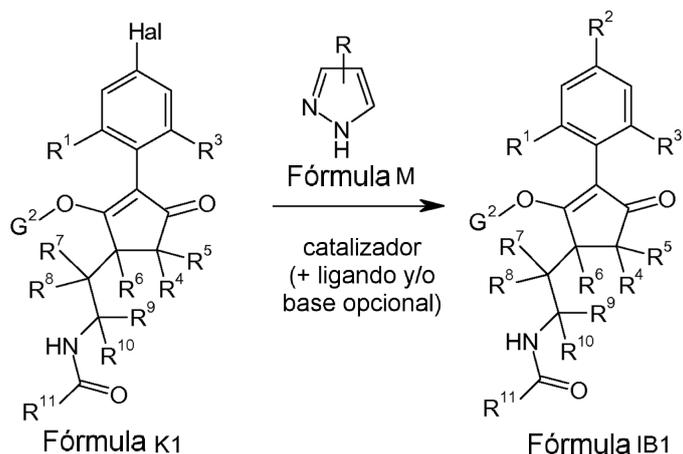
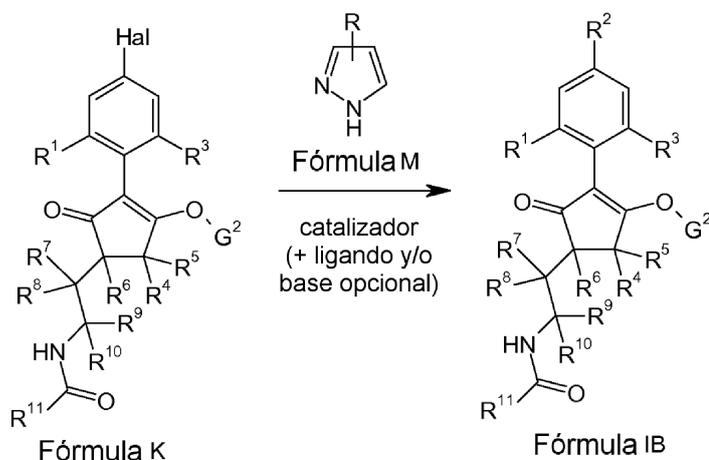


10 Los reactivos habituales para el proceso de acoplamiento mostrado anteriormente (los reactivos utilizados en el Intermedio 1 de la presente y en el documento WO 2010/000773 A1) son fosfato de potasio, Pd(OAc)₂ y S-Phos (que es 2-(diclohexilfosfino)-2',6'-dimetoxibifenilo). El ácido 2,4,6-trimetilfenilborónico mostrado anteriormente se puede adquirir de proveedores comerciales.



En otro método, un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde R^2 = fenilo opcionalmente sustituido, alquilo C_1-C_3 o ciclopropilo, y donde G^2 es normalmente alquilo C_1-C_6 , $-C(O)O$ (alquilo C_1-C_6), $-C(O)NH$ -(alquilo C_1-C_6) o $-C(O)N$ (alquilo C_1-C_6)₂, se puede preparar mediante la reacción de los compuestos de Fórmula K o K1, respectivamente (donde Hal = Cl, Br o I, o un "pseudohalógeno" adecuado tal como trifluorometanosulfonato) con un compuesto de Fórmula L en presencia de un catalizador adecuado, y/o en presencia de una base adecuada, normalmente a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico y/o no acuoso), p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Los catalizadores adecuados incluyen bis(difenilfosfino)ferroceno-dicloropaladio (II) (remítase a, por ejemplo, A.M Thompson, H.S. Sutherland, B.D. Palmer, I. Kmentova, A. Blaser, W.A. Denny, S.G. Franzblau, B. Wan, Y. Wang, Z. Ma, *Journal of Medicinal Chemistry*, (2011), 54(19), 6563-6585). Las bases adecuadas incluyen fluoruro de cesio. Los disolventes adecuados incluyen 1,4-dioxano. Las temperaturas adecuadas varían entre temperatura ambiente (p. ej., 15-30 °C) y 140 °C.

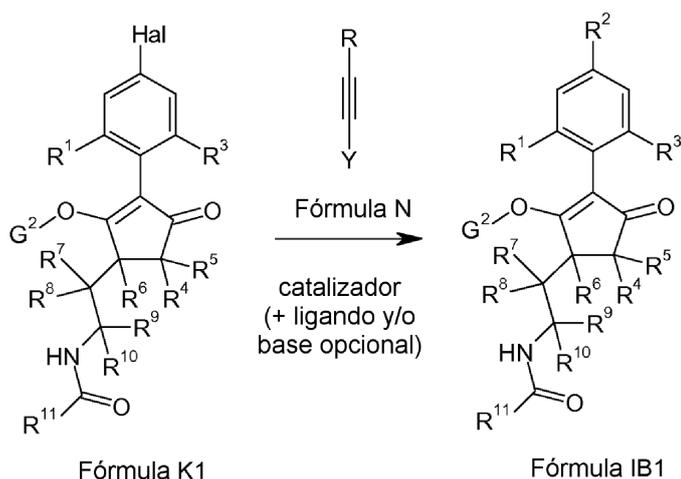
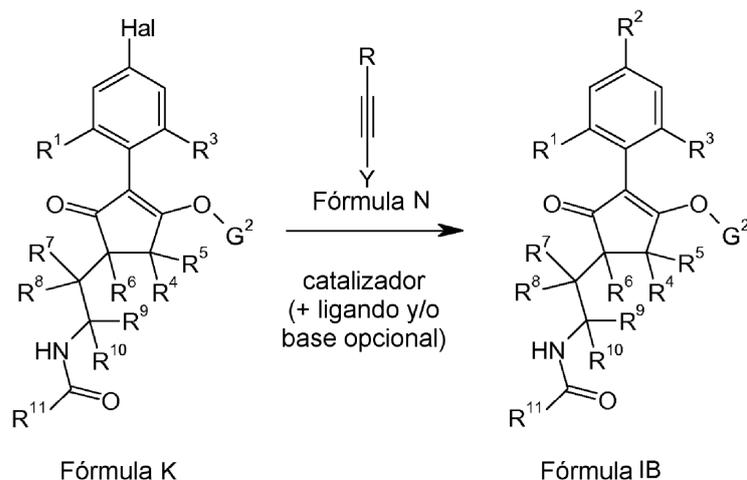
Los compuestos de Fórmula L se pueden preparar mediante métodos conocidos.



5 En un método adicional, un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde R^2 = pirazol-1-ilo opcionalmente sustituido y donde G^2 es normalmente alquilo C_1-C_6 , $-C(O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-C(O)NH(\text{alquilo } C_1-C_6)$ o $-C(O)N(\text{alquilo } C_1-C_6)_2$, se puede preparar mediante la reacción de los compuestos de Fórmula K o K1, respectivamente (donde Hal = Cl, Br o I, o un "pseudohalógeno" adecuado tal como trifluorometanosulfonato) con compuestos de Fórmula M en presencia de un catalizador adecuado, opcionalmente en presencia de un ligando adecuado, opcionalmente en presencia de una base adecuada, normalmente a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico), p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Los catalizadores adecuados incluyen yoduro de cobre (I) (remítase a, por ejemplo, H. Zhang, Q. Cai, D. Ma, *Journal of Organic Chemistry*, (2005), 70(13), 5164-5173) o tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (0) (remítase a, por ejemplo, S. Tasler, J. Mies, M. Lang, *Advanced Synthesis and Catalysis*, (2007), 349(14-15), 2286-2300). Los ligandos adecuados incluyen dimetilglicina o 2-di-*tert*-butilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenilo. Las temperaturas adecuadas varían entre temperatura ambiente y 180 °C. Las bases adecuadas incluyen carbonato de potasio o hidruro sódico. Los disolventes adecuados incluyen sulfóxido de dimetilo, tolueno o éter dietilenglicol dimetílico.

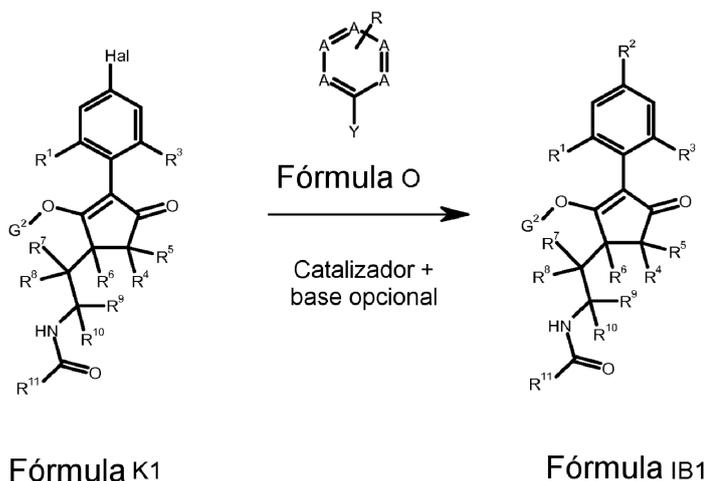
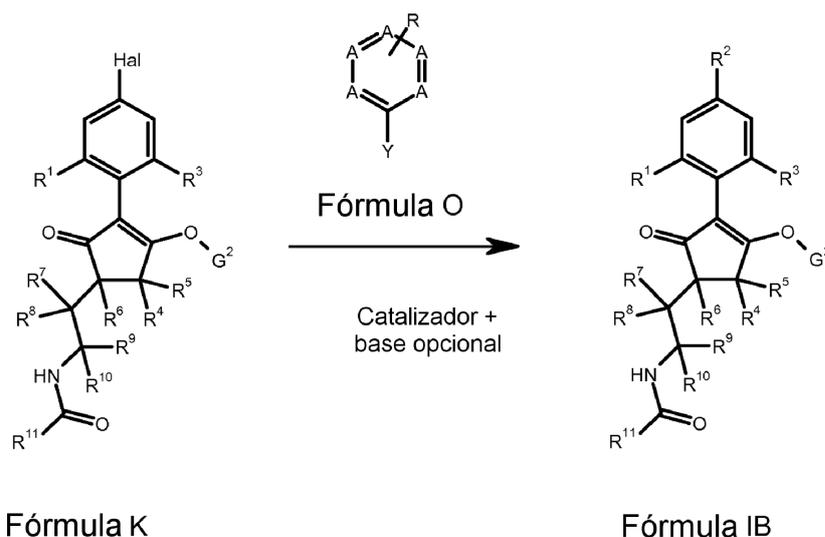
Los compuestos de Fórmula M están disponibles o se pueden preparar mediante métodos conocidos.

Para consultar un método de preparación de los compuestos de fórmula (I) donde R^2 es 1,2,3-triazol-1-ilo opcionalmente sustituido, remítase al Ejemplo 11 (síntesis del compuesto A170) posteriormente en la presente.

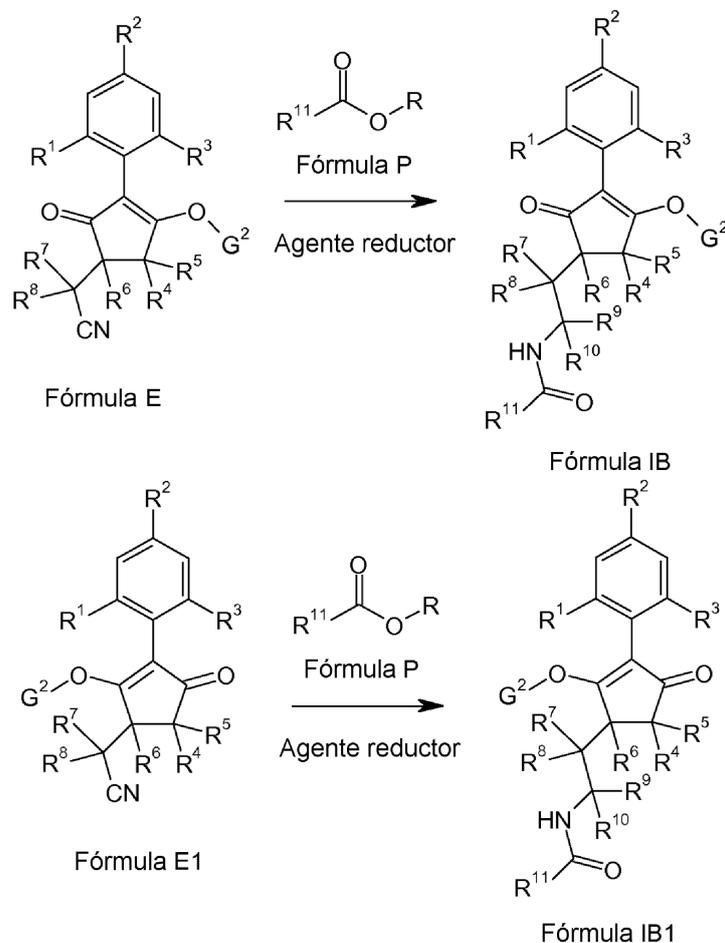


En otro método, un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde R^2 = alquín-1-ilo opcionalmente sustituido (según se define en la presente) y donde G^2 es normalmente alquilo C_1-C_6 , $-C(O)O$ (alquilo C_1-C_6), $-C(O)NH$ (alquilo C_1-C_6) o $-C(O)N$ (alquilo C_1-C_6)₂, se puede preparar mediante la reacción de los compuestos de Fórmula K o K1, respectivamente (donde R es adecuado para formar en la fórmula I un R^2 = alquín-1-ilo opcionalmente sustituido como se ha definido en la presente) con compuestos de Fórmula N (donde Y es un grupo de acoplamiento cruzado adecuado tal como H, CO_2H , Bu_3Sn) en presencia de un catalizador adecuado, normalmente a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico), opcionalmente en presencia de un ligando adecuado y/o una base adecuada, p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Los catalizadores adecuados incluyen [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]-dicloropaladio (II), yoduro de cobre (I) o dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) (remítase a, por ejemplo, Y. Okuno, M. Yamashita, K. Nozaki, *European Journal of Organic Chemistry*, (2011), 20-21, 3951-3958). Los ligandos adecuados incluyen 1,4-bis(difenilfosfino)butano. Las bases adecuadas incluyen fluoruro de cesio o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las temperaturas adecuadas varían entre temperatura ambiente (p. ej., 15-30 °C) y 140 °C. Los disolventes adecuados incluyen *N,N*-dimetilformamida o sulfóxido de dimetilo.

Los compuestos de Fórmula N se pueden preparar mediante métodos conocidos.

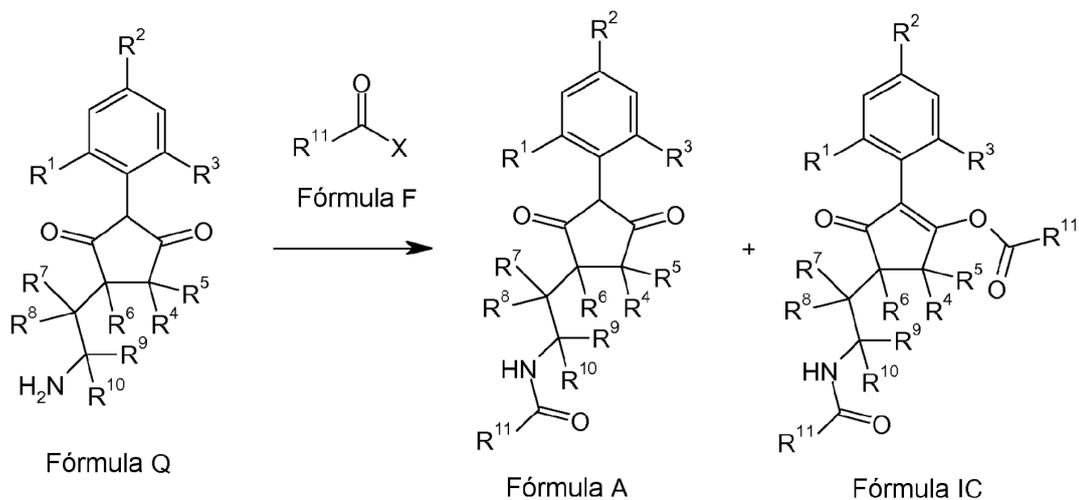


En un método adicional, un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde R^2 = heteroarilo opcionalmente sustituido (p. ej., heteroarilo de 6 miembros opcionalmente sustituido) y donde G^2 es normalmente alquilo C_1-C_6 , $-C(O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-C(O)NH(\text{alquilo } C_1-C_6)$ o $-C(O)N(\text{alquilo } C_1-C_6)_2$, se puede preparar mediante las reacciones de los compuestos de Fórmula K o K1, respectivamente, con compuestos de Fórmula O (donde Y es un grupo complementario de acoplamiento cruzado adecuado, p. ej., $B(OH)_2$ o Bu_3Sn , y cada A es independientemente C-R o N) en presencia de un catalizador adecuado, normalmente a una temperatura adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico), opcionalmente en presencia de un ligando adecuado y/o una base adecuada, p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Los catalizadores adecuados incluyen [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]-dicloropaladio (II) (remítase a, p. ej., N. Joubert, M. Urban, R. Pohl, M. Hocek, *Synthesis*, (2008), 12, 1918-1932) y yoduro de cobre (I). Las bases adecuadas incluyen fluoruro de cesio. Los disolventes adecuados incluyen *N,N*-dimetilformamida. Las temperaturas adecuadas varían entre temperatura ambiente (p. ej., 15-30 °C) y 140 °C.



- En otro método más, un compuesto de Fórmula IB o IB1 (el cual es en ocasiones también un compuesto de Fórmula (I) o (IA), respectivamente), donde G² es normalmente alquilo C₁-C₆, -C(O)O(alquilo C₁-C₆), -C(O)NH-(alquilo C₁-C₆) o -C(O)N(alquilo C₁-C₆)₂, se puede preparar mediante la reducción de los compuestos de Fórmula E o E1 en presencia de compuestos de Fórmula P (en los que O-R es un grupo saliente adecuado, por ejemplo, pentafluorofenoxi), en presencia de un agente reductor adecuado, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., orgánico) y/o en presencia de un catalizador adecuado, p. ej., como se ha mostrado anteriormente. Los agentes reductores adecuados incluyen borohidruro de sodio e hidrógeno gaseoso. Los disolventes adecuados incluyen metanol, tetrahidrofurano o 1,4-dioxano. Los catalizadores adecuados incluyen NiCl₂ o níquel Raney®
- 5
- 10 (remítase a, por ejemplo, D.E. González-Juárez, J.B. García-Vázquez, V. Zúniga-García, J.J. Trujillo-Serrato, P. Joseph-Nathan, M.S. Morales-Ríos, O.R. Suárez-Castillo, *Tetrahedron*, (2012), 68 (35), 7187-7195).

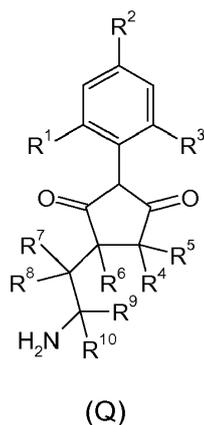
Los compuestos de Fórmula P se pueden preparar mediante métodos conocidos.



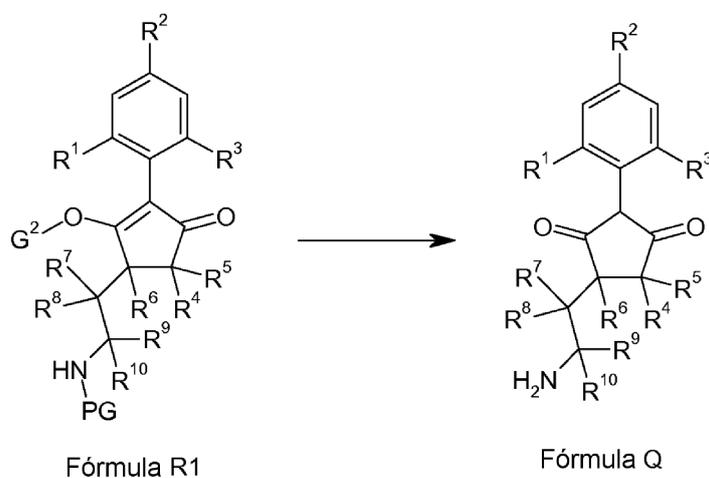
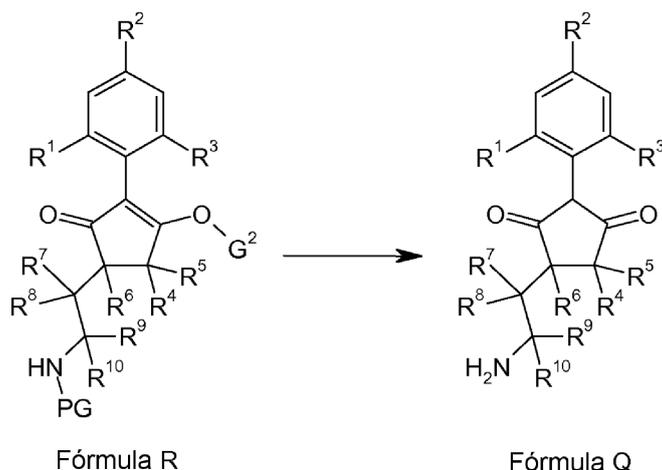
- Un compuesto de fórmula (I), el cual es un compuesto de Fórmula A o de Fórmula IC, se puede preparar mediante una reacción de formación de un enlace amídico y/o de tipo éster entre un compuesto de Fórmula Q, o una de sus sales en particular una de sus sales de adición de ácido (p. ej., sal de HCl), y un compuesto de Fórmula F, donde X = halógeno, OH u OR (siendo OR un grupo saliente enlazado a través del oxígeno, p. ej., pentafluorofenoxi o, p. ej., un sulfonato de alquilo, fluoroalquilo o arilo tal como metanosulfonato, trifluorometanosulfonato o *para*-toluenosulfonato), p. ej., según se ha mostrado anteriormente. La reacción de formación del enlace amídico se lleva a cabo habitualmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., un disolvente orgánico y/o no acuoso) y/o en presencia de un reactivo de acoplamiento adecuado, y/o en presencia de una base adecuada. Los disolventes adecuados incluyen *N,N*-dimetilformamida o diclorometano. Los reactivos de acoplamiento adecuados incluyen una carbodiimida (p. ej., diciclohexilcarbodiimida, "DCC") o un anhídrido fosfónico (p. ej., 2,4,6-tripropil-1,3,5,2,4,6-trioxatрифосфоринан-2,4,6-trióxido) o una sal de (benzotriazol-1-iloxi)trialquilaminofosfonio (p. ej., hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxi(tripirrolidin-1-il)fosfonio). Las bases adecuadas incluyen bases orgánicas no acuosas tales como aminas terciarias como, por ejemplo, *N,N*-diisopropiletilamina o trietilamina.
- El Ejemplo 16B posteriormente en la presente es un ejemplo de un compuesto de Fórmula Q (como sal de HCl) que se convierte en un compuesto de Fórmula IC.

Los compuestos de Fórmula F se pueden preparar mediante métodos conocidos.

La presente invención también proporciona un compuesto de fórmula (Q):

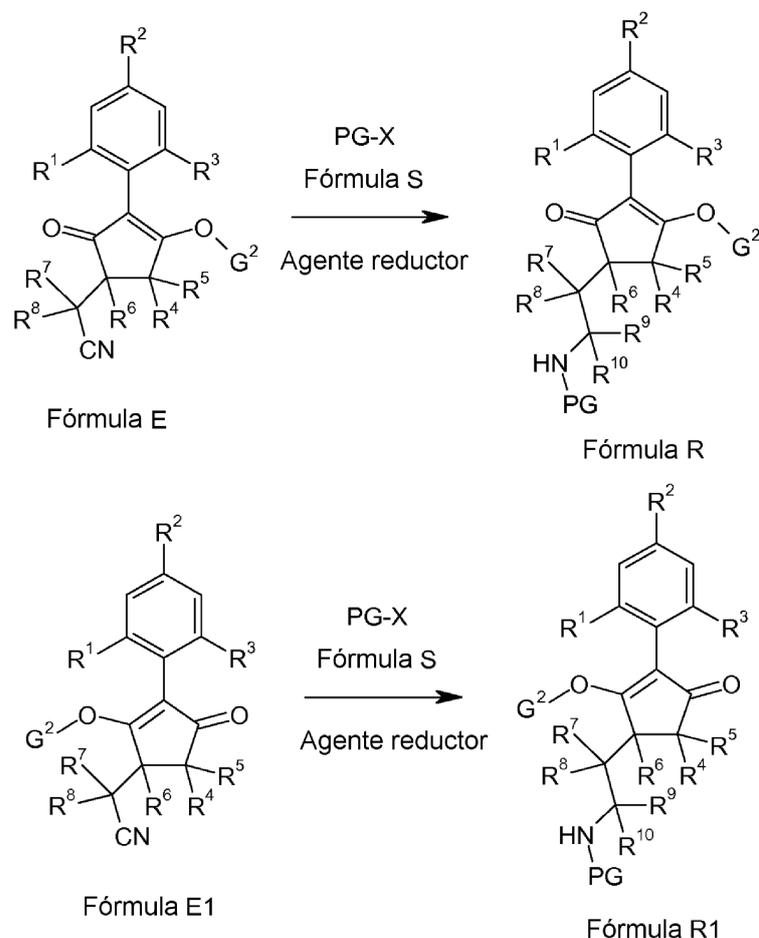


- o una de sus sales (en particular una de sus sales de adición de ácido, p. ej., sal de HCl y/o en particular una de sus sales agroquímicamente aceptables), donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se han definido en la presente.



Un compuesto de Fórmula Q o una de sus sales (p. ej., sal de adición de ácido, p. ej., sal de HCl) se puede preparar a partir de un compuesto de Fórmula R o R1, p. ej., según se ha mostrado anteriormente, eliminando el grupo protector PG unido al compuesto de Fórmula R o R1, donde PG es un grupo protector adecuado, preferentemente *tert*-butiloxicarbonilo (*t*-Boc), carboxibencilo (CBz), *para*-toluenosulfonilo (tosyl, Ts), *para*-bromobencenosulfonilo, 2- o 4- nitrobencenosulfonilo (nosilo, Nos), 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo (Troc), bencilo (Bn), *p*-metoxibencilo (PMB), fluorenilmetiloxicarbonilo (Fmoc) o cualquier otro grupo protector adecuado. La eliminación del grupo protector PG se lleva a cabo habitualmente en presencia de un disolvente adecuado (p. ej., un disolvente orgánico y/o acuoso), en presencia de un ácido, una base, un agente reductor y/o un agente oxidante adecuado. Los disolventes adecuados incluyen *N,N*-dimetilformamida, diclorometano, tetrahidrofurano, éter dietílico, agua, acetato de etilo o acetona o mezclas de estos. Los ácidos adecuados incluyen ácido trifluoroacético, ácido clorhídrico o ácido triflórico (ácido trifluorometanosulfónico). Las bases adecuadas incluyen aminas terciarias tales como *N,N*-diisopropiletilamina o trietilamina, o un alcóxido de un metal o un hidróxido de un metal o morfolina. Los agentes reductores adecuados incluyen zinc, hidrógeno gaseoso en presencia de catalizadores metálicos adecuados, metales alcalinos disueltos en amoníaco, o una amalgama de sodio. Un agente oxidante adecuado incluye el nitrato de amonio cérico (CAN, por sus siglas en inglés).

El Ejemplo 16B posteriormente en la presente incluye un ejemplo de una sal de HCl de un compuesto de Fórmula Q que se prepara partir de un compuesto de Fórmula R1 donde PG es *tert*-butiloxicarbonilo (*t*-Boc) y G² es metilo.



Los compuestos de Fórmula R o R1 se pueden preparar mediante la reducción de los compuestos de Fórmula E o E1, respectivamente, en presencia de compuestos de Fórmula S (donde X es un grupo saliente adecuado, por ejemplo, halógeno o anhídrido donde X = O-PG) en presencia de un agente reductor adecuado, opcionalmente en presencia de un disolvente (p. ej., orgánico) adecuado y/o en presencia de un catalizador adecuado. Los agentes reductores adecuados incluyen hidrógeno gaseoso o borohidruro de sodio. Los disolventes adecuados incluyen metanol, tetrahidrofurano o 1,4-dioxano. Los catalizadores adecuados incluyen NiCl₂ o níquel Raney® (remítase, por ejemplo, a D.E. Gonzalez-Juarez, J.B. Garcia-Vazquez, V. Zuniga-Garcia, J.J. Trujillo-Serrato, P. Joseph-Nathan, M.S. Morales-Rios, O.R. Suarez-Castillo, *Tetrahedron*, (2012), 68 (35), 7187-7195).

Los compuestos de Fórmula S se pueden preparar mediante métodos conocidos.

Composiciones herbicidas

En otro aspecto, la presente invención proporciona una composición herbicida, p. ej., para su uso en un método para controlar malezas (p. ej., monocotiledóneas tales como malezas herbáceas) en cultivos de plantas útiles, cuya composición comprende un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la presente (p. ej., una cantidad eficaz como herbicida de este) y una sustancia agroquímicamente aceptable sustancialmente inerte (p. ej., un portador, diluyente y/o disolvente agroquímicamente aceptable, un adyuvante agroquímicamente aceptable, un emulsionante/surfactante/sustancia tensioactiva agroquímicamente aceptable y/u otro aditivo agroquímicamente aceptable).

En un aspecto adicional, la presente invención proporciona una composición herbicida, p. ej., para su uso en un método para controlar malezas (p. ej., monocotiledóneas tales como malezas herbáceas) en cultivos de plantas útiles, que comprende un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la presente (p. ej., una cantidad eficaz como herbicida de este) y un portador, diluyente y/o disolvente agroquímicamente aceptable.

En todos los aspectos de la invención, el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente (p. ej., cuando sea químicamente posible) como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden utilizarse como agentes para la protección de cultivos en forma no modificada, tal como se obtienen mediante síntesis, pero, para su uso como herbicidas, generalmente se formulan en composiciones herbicidas (formulaciones), p. ej., de varios modos, que contienen una

o más sustancias agroquímicamente aceptables sustancialmente inertes (p. ej., un portador, diluyente y/o disolvente agroquímicamente aceptable, un adyuvante agroquímicamente aceptable, un emulsionante/surfactante/sustancia tensioactiva agroquímicamente aceptable y/u otro aditivo agroquímicamente aceptable).

5 Las formulaciones (composiciones herbicidas) pueden estar en varias formas físicas, por ejemplo, en forma de polvos espolvoreables, geles, polvos humectables, gránulos recubiertos o impregnados para la distribución mecánica o manual en sitios diana, gránulos dispersables en agua, gránulos hidrosolubles, gránulos emulsionables, comprimidos dispersables en agua, comprimidos efervescentes, cintas hidrosolubles, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua (EW, por sus siglas en inglés) o agua en aceite (WO, por sus siglas en inglés), otros sistemas multifásicos tales como productos de aceite/agua/aceite y agua/aceite/agua, fluidos oleosos, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspoemulsiones, suspensiones de cápsulas, líquidos solubles, concentrados hidrosolubles (con agua o un disolvente orgánico hidromiscible como portador), películas poliméricas impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo, del Manual de elaboración y empleo de las Especificaciones de la FAO para los Productos destinados a la protección de plantas, 5.^a Edición, 1999. El principio activo se puede incorporar en microfibras o microvarillas formadas a partir de polímeros o monómeros polimerizables, y que tienen un diámetro de entre aproximadamente 0.1 y aproximadamente 50 micrones, y una relación entre dimensiones de entre aproximadamente 10 y aproximadamente 1000.

20 Tales formulaciones pueden utilizarse directamente o diluirse antes de usarlas. Pueden aplicarse posteriormente con un equipo de pulverización para la aplicación aérea o al suelo adecuada, u otro equipo de aplicación al suelo tal como sistemas de riego móviles centrales o medios de riego por goteo. Las formulaciones diluidas se pueden preparar, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

25 Las formulaciones se pueden preparar, por ejemplo, mezclando el principio activo con adyuvantes de formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, soluciones, dispersiones o emulsiones. Los principios activos también pueden estar contenidos en microcápsulas finas constituidas por un núcleo y una cubierta polimérica. Las microcápsulas suelen tener un diámetro de entre 0.1 y 500 micrones, y contienen principios activos en una cantidad comprendida entre aproximadamente un 25 y un 95% en peso del peso de la cápsula. Los principios activos pueden presentarse en forma de material técnico líquido, en forma de una solución adecuada, en forma de partículas finas en dispersión sólida o líquida, o como un sólido monolítico. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, gomas naturales o sintéticas, celulosa, copolímeros de estireno-butadieno u otro material que forme membranas adecuadas similar, poliacrilonitrilo, poliacrilato, poliéster, poliamidas, poliureas, poliuretano, resinas aminoplast o almidón modificado químicamente, u otros polímeros con los que esté familiarizado un experto en la técnica a este respecto.

35 Como alternativa, es posible que se formen las denominadas "microcápsulas" finas en las que el principio activo está presente en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de una sustancia base, pero en tal caso la microcápsula no está encapsulada con una membrana que limite la difusión como la que se ha descrito en el párrafo anterior.

Los principios activos se pueden adsorber en un portador poroso. Esto puede permitir que los principios activos se liberen en sus entornos en cantidades controladas (p. ej., liberación lenta).

40 Otras formas de formulaciones de liberación controlada son gránulos o polvos en los que el principio activo se dispersa o se disuelve en una matriz sólida constituida por un polímero, una cera o una sustancia sólida adecuada de peso molecular inferior. Los polímeros adecuados son acetatos de polivinilo, poliestirenos, poliolefinas, alcoholes polivinílicos, polivinilpirrolidonas, polivinilpirrolidonas alquiladas, copolímeros de polivinilpirrolidonas y anhídrido maleico, y sus ésteres y semiestéres, ésteres de celulosa modificada químicamente como carboximetilcelulosa, metilcelulosa o hidroxietilcelulosa. Algunos ejemplos de ceras adecuadas son cera de polietileno, cera de polietileno oxidada, ceras de tipo éster como las ceras de lignito, ceras de origen natural tales como la cera de carnaúba, cera de candelilla, cera de abeja, etc. Otros materiales matriciales adecuados para las formulaciones de liberación lenta son almidón, estearina y lignina.

Los ingredientes de la formulación (p. ej., ingredientes inertes) adecuados para preparar las composiciones de acuerdo con la invención generalmente son conocidos de por sí.

50 Como portador líquido y/o disolvente (p. ej., disolvente orgánico), p. ej., para su uso en la composición o las composiciones herbicidas de acuerdo con la invención, se pueden utilizar: agua, un disolvente aromático tal como tolueno, *m*-xileno, *o*-xileno, *p*-xileno o una mezcla de estos, cumeno, una mezcla de hidrocarburos aromáticos con un rango de ebullición de entre 140 y 320 °C (p. ej., conocidos con varios nombres comerciales tales como Solvesso®, Shellsol A®, Caromax®, Hydrosol®), un portador parafínico o isoparafínico tal como aceite de parafina, aceite mineral, un disolvente hidrocarbonado desaromatizado con un rango de ebullición de entre 50 y 320 °C (p. ej., conocido, por ejemplo, con el nombre comercial Exsol®), un disolvente hidrocarbonado no desaromatizado con un rango de ebullición de entre 100 y 320 °C (p. ej., conocido con el nombre comercial Varsol®), un disolvente isoparafínico con un rango de ebullición de entre 100 y 320 °C (p. ej., conocido con nombres comerciales como Isopar® o Shellsol T®), un hidrocarburo tal como ciclohexano, tetrahidronaftaleno (tetralina), decahidronaftaleno, alfa-pineno, d-limoneno, hexadecano, isoctano; un disolvente de tipo éster tal como acetato de etilo, acetato de *n*-

isobutilo, acetato de amilo, acetato de isobornilo, acetato de 2-etilhexilo, un éster alquílico C_6-C_{18} del ácido acético (p. ej., conocido con el nombre comercial Exxate®), éster etílico del ácido láctico, éster propílico del ácido láctico, éster butílico del ácido láctico, benzoato de bencilo, lactato de bencilo, dibenzoato de dipropilenglicol o un éster dialquílico del ácido succínico, maleico o fumárico; un disolvente polar tal como *N*-metilpirrolidona, *N*-etilpirrolidona, (alquil C_3-C_{18})pirrolidonas, gamma-butirolactona, sulfóxido de dimetilo, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N,N*-dimetilactamida, una dimetilamida de un ácido graso C_4-C_{18} , dimetilamida del ácido benzoico, acetonitrilo, acetona, cetona etil metílica, cetona isobutil metílica, cetona isoamílica, 2-heptanona, ciclohexanona, isoforona, cetona isobutenil metílica (óxido de mesitilo), acetofenona, carbonato de etileno, carbonato de propileno o carbonato de butileno;

un diluyente o disolvente alcohólico tal como metanol, etanol, propanol, *n*- o isobutanol, *n*- o isopentanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, 2-metil-2,4-pentanodiol, 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, ciclohexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, éter butil etilenglicólico, éter etilenglicol metílico, dietilenglicol, éter butil dietilenglicólico, éter dietilenglicol monoetilico, éter dietilenglicol monometílico, propilenglicol, dipropilenglicol, éter dipropilenglicol monometílico u otro disolvente de tipo monoéter glicólico similar basado en etilenglicol, propilenglicol o butilenglicol como materia prima, trietilenglicol, polietilenglicol (p. ej., PEG 400), un polipropilenglicol con una masa molecular de 400-4000, o glicerol;

acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, 1,4-dioxano, abietato de dietilenglicol, clorobenceno, clorotolueno; un éster de un ácido graso tal como octanoato de metilo, miristato de isopropilo, laurato de metilo, oleato de metilo, una mezcla de ésteres metílicos de ácidos grasos C_8-C_{10} , éster metílico de aceite de colza, éster etílico de aceite de colza, éster metílico de aceite de soja, éster etílico de aceite de soja; un aceite vegetal (p. ej., aceite de colza o aceite de soja); un ácido graso tal como el ácido oleico, ácido linoleico o ácido linoléico; o un éster del ácido fosfórico o fosfónico tal como fosfato de trietilo, un fosfato de tris(alquilo C_3-C_{18}), un fosfato de alquilarilo o fosfonato de bis(octil)octilo.

Generalmente, el portador líquido elegido para la dilución de los concentrados es agua.

Algunos portadores sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla pirofílica, sílice (sílice pirogénica o precipitada y opcionalmente funcionalizada o tratada, por ejemplo, silanizada), arcilla atapulgítica, diatomita, caliza, carbonato de calcio, bentonita, montmorillonita cálcica, vainas de semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, pumita, harina de madera, cáscaras de nueces molidas, lignina y materiales similares, como los que se describen, por ejemplo, en EPA CFR 180.1001. (c) y (d). También pueden utilizarse fertilizantes en polvo o granulados como portadores sólidos.

Un gran número de sustancias tensioactivas pueden utilizarse de forma ventajosa tanto en las formulaciones sólidas como líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que pueden diluirse con un portador antes de usarlas. Las sustancias tensioactivas pueden ser aniónicas, catiónicas, anfóteras, no iónicas o poliméricas y se pueden utilizar como agentes emulsionantes, humectantes, dispersantes o de suspensión, o con otros fines. Las sustancias tensioactivas típicas incluyen, por ejemplo, sales de alquilsulfatos, tales como laurilsulfato de dietanolamonio; laurilsulfato de sodio, sales de alquilarilsulfonatos, tales como dodecibencenosulfonato de calcio o sodio; productos de la adición de alquilfenol-óxido de alquileo, tales como etoxilato de nonilfenol; productos de la adición de alcohol-óxido alquileo, tales como etoxilato de alcohol tridecílico; jabones, tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonatos, tales como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato sódico; ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio, ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres fosfato mono- y dialquílicos; y también otras sustancias descritas, p. ej., en "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Ridgewood, Nueva Jersey, 1981.

Otros adyuvantes que se pueden utilizar normalmente en formulaciones pesticidas incluyen inhibidores de la cristalización, sustancias modificadoras de la viscosidad, agentes de suspensión, tintes, antioxidantes, agentes espumantes, absorbentes de luz, auxiliares de mezcla, antiespumantes, agentes complejantes, sustancias que neutralizan o modifican el pH y tampones, inhibidores de la corrosión, fragancias, agentes humectantes, potenciadores de la absorción, micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas, agentes que mejoran la compatibilidad y solubilizantes, y también fertilizantes líquidos y sólidos.

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

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir además un aditivo (denominado habitualmente adyuvante) que comprenda un aceite mineral, un aceite de origen animal o vegetal, ésteres alquílicos de tales aceites o mezclas de tales aceites y derivados oleosos. La cantidad de aditivo oleoso utilizada en la composición de acuerdo con la invención está comprendida generalmente entre un 0.01 y un 10%, respecto a la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso se puede añadir al tanque de pulverización en la concentración deseada después de haber preparado la mezcla de pulverización. Los aditivos oleosos preferidos comprenden aceites

minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo, aceite de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionable, tal como AMIGO® (Loveland Products Inc.), ésteres alquílicos C₁-C₆ de aceites de origen vegetal, por ejemplo, los ésteres metílicos, o un aceite de origen animal tal como aceite de pescado o sebo bovino. Un aditivo oleoso preferido contiene aceite de colza metilado. Otro aditivo oleoso preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos esencialmente un 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y un 15% en peso de aceite de colza metilado, y también un 5% en peso de emulsionantes habituales y modificadores del pH. Los aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden uno o más ésteres alquílicos C₁-C₆ de uno o más ácidos grasos C₈-C₂₂, especialmente el o los ésteres metílicos de uno o más ácidos grasos C₈-C₂₂ (especialmente C₁₂-C₁₈); preferentemente el éster metílico del ácido láurico, del ácido palmítico o del ácido oleico. Estos ésteres se conocen como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9), respectivamente. Un derivado de tipo éster metílico de un ácido graso preferido es AGNIQUE ME 18 RD-F® (p. ej., comercializado por Cognis). Estos y otros derivados oleosos también se encuentran en el *Compendium of Herbicide Adjuvants*, 5.^a edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y la acción de los aditivos oleosos se pueden mejorar además combinándolos con sustancias tensioactivas tales como surfactantes no iónicos, aniónicos, catiónicos o anfóteros. En las páginas 7 y 8 de WO97/34485 se enumeran ejemplos de surfactantes aniónicos, no iónicos, catiónicos o anfóteros adecuados. Las sustancias tensioactivas preferidas son surfactantes aniónicos del tipo dodecilsulfonato, especialmente sus sales de calcio, y también surfactantes no iónicos del tipo alcohol graso etoxilado. Se prefieren especialmente los alcoholes grasos C₁₂-C₂₂ etoxilados preferentemente con un grado de etoxilación comprendido entre 5 y 40. Algunos ejemplos de surfactantes que se pueden adquirir de proveedores comerciales son los de tipo Genapol (Clariant). También se prefieren los surfactantes de silicona, especialmente heptametiltrisiloxanos modificados con óxido de polialquilo, los cuales se pueden adquirir de proveedores comerciales, p. ej., como SILWET L-77®, y también surfactantes perfluorados. La concentración de sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total está comprendida generalmente entre un 1 y un 50% en peso. Algunos ejemplos de aditivos oleosos que están constituidos por mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de estos con surfactantes son TURBOCHARGE®, ADIGOR® (ambos de Syngenta Crop Protection AG), ACTIPRON® (BP Oil UK Limited), AGRIDEX® (Helena Chemical Company).

Las sustancias tensioactivas mencionadas anteriormente también pueden emplearse en las formulaciones solas, es decir, sin aditivos oleosos.

Además, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/surfactante puede contribuir a una mejora adicional de la acción. Algunos disolventes adecuados son, por ejemplo, los disolventes SOLVESSO® y AROMATIC® (Exxon Corporation). La concentración de tales disolventes puede estar comprendida entre un 10 y un 80% en peso del peso total. Tales aditivos oleosos, que pueden estar mezclados con disolventes, se describen, por ejemplo, en US 4 834 908. Un aditivo oleoso que se puede adquirir de proveedores comerciales descrito en el citado documento se conoce con el nombre de MERGE® (BASF). Otros aditivos oleosos que se prefieren de acuerdo con la invención son SCORE® y ADIGOR® (ambos de Syngenta Crop Protection AG).

Además de los aditivos oleosos enumerados anteriormente, para mejorar la actividad de las composiciones de acuerdo con la invención también es posible añadir formulaciones de alquilpirrolidonas (p. ej., AGRIMAX® de ISP) a la mezcla de pulverización. También se pueden utilizar formulaciones de estructuras sintéticas tales como, por ejemplo, poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-*p*-menteno (p. ej., BOND®, COURIER® o EMERALD®).

Tales aceites adyuvantes, tal como se han descrito en los párrafos anteriores, se pueden emplear como el líquido portador en el que un compuesto activo se disuelve, emulsiona o dispersa, según sea adecuado para la forma física del compuesto activo.

Las formulaciones pesticidas generalmente comprenden entre un 0.1 y un 99% en peso, especialmente entre un 0.1 y un 95% en peso, de un compuesto 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. Aunque los productos comerciales se formulen preferentemente como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

La tasa de aplicación de los compuestos de fórmula I puede variar dentro de límites amplios y depende 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 hierba que se desee controlar, las condiciones climáticas predominantes 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 generalmente se aplican en una tasa de 1-2000 g/ha, preferentemente 1-1000 g/ha y aún más preferentemente 1-500 g/ha.

Las formulaciones/composiciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones representativas:

(% = porcentaje en peso de la composición):

Concentrados emulsionables:

ES 2 642 195 T3

principio activo:	entre un 0.3 y un 95%, preferentemente entre un 0.5 y un 60% tal como entre un 1 y un 40%
agentes tensioactivos:	entre un 1 y un 30%, preferentemente entre un 3 y un 20% tal como entre un 5 y un 15%
disolventes como portador líquido:	entre un 1 y un 80%, preferentemente entre un 1 y un 60% tal como entre un 1 y un 40%

Polvos:

principio activo:	entre un 0.1 y un 10%, preferentemente entre un 0.1 y un 5%
portadores sólidos:	entre un 99.9 y un 90%, preferentemente entre un 99.9 y un 99%

Concentrados en suspensión:

principio activo:	entre un 1 y un 75%, preferentemente entre un 3 y un 50% o entre un 10 y un 50%
agua:	entre un 98 y un 24%, preferentemente entre un 95 y un 30% o entre un 88 y un 30%
agentes tensioactivos:	entre un 1 y un 40%, preferentemente entre un 2 y un 30%

5

Polvos humectables:

principio activo:	entre un 0.5 y un 90%, preferentemente entre un 1 y un 80%
agentes tensioactivos:	entre un 0.5 y un 20%, preferentemente entre un 1 y un 15%
portadores sólidos:	entre un 5 y un 95%, preferentemente entre un 15 y un 90%

Gránulos:

principio activo:	entre un 0.1 y un 30%, preferentemente entre un 0.1 y un 15%
portadores sólidos:	entre un 99.5 y un 70%, preferentemente entre un 97 y un 85%

10 Gránulos dispersables en agua:

principio activo:	entre un 1 y un 90%, preferentemente entre un 10 y un 80%
agentes tensioactivos:	entre un 0.5 y un 80%, preferentemente entre un 5 y un 30%
portadores sólidos:	entre un 90 y un 10%, preferentemente entre un 70 y un 30%

Los siguientes ejemplos ilustran la invención aún más pero sin limitarla.

<u>F1. Concentrados emulsionables</u>	a)	b)	c)	d)
principio activo	5%	10%	25%	50%
dodecibencenosulfonato de calcio	6%	8%	6%	8%
éter poliglicólico de aceite de ricino (36 mol de óxido de etileno)	4%	-	4%	4%
éter octilfenol poliglicólico (7-8 mol de óxido de etileno)	-	4%	-	2%
NMP (N-metil-2-pirrolidona)	-	10%	-	20%

ES 2 642 195 T3

mezcla de hidrocarburos aromáticos C ₉ -C ₁₂	85%	68%	65%	16%
--	-----	-----	-----	-----

Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados diluyendo con agua.

<u>F2. Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
principio activo	5%	10%	50%	90%
1-metoxi-3-(3-metoxipropoxi)propano	40%	50%	-	-
polietilenglicol PM 400	20%	10%	-	-
NMP (N-metil-2-pirrolidona)	-	-	50%	10%
mezcla de hidrocarburos aromáticos C ₉ -C ₁₂	35%	30%	-	-

5 La solución son adecuadas para la aplicación sin diluir o después de diluirlas en agua.

<u>F3. Polvos humectables</u>	a)	b)	c)	d)
principio activo	5%	25%	50%	80%
lignosulfonato de sodio	4%	-	3%	-
laurilsulfato de sodio	2%	3%	-	4%
diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6%	5%	6%
éter octilfenol poliglicólico (7-8 mol de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
ácido silícico muy disperso	1%	3%	5%	10%
caolín	88%	62%	35%	-

El principio activo se mezcla exhaustivamente con los adyuvantes y la mezcla se muele exhaustivamente en un molino adecuado para obtener polvos humectables que se pueden diluir con agua para obtener suspensiones de cualquier concentración deseada.

<u>F4. Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
principio activo	0.1%	5%	15%
silice muy dispersa	0.9%	2%	2%
portador inorgánico (diámetro 0.1-1 mm), p. ej., CaCO ₃ o SiO ₂	99.0%	93%	83%

10 El principio activo se disuelve en cloruro de metileno, la solución se pulveriza sobre el portador y el disolvente se evapora subsecuentemente al vacío.

<u>F5. Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
principio activo	0.1%	5%	15%
polietilenglicol PM 200	1.0%	2%	3%
silice muy dispersa	0.9%	1%	2%
portador inorgánico (diámetro 0.1-1 mm), p. ej., CaCO ₃ o SiO ₂	98.0%	92%	80%

15 El principio activo finamente molido se aplica de forma uniforme, en una mezcladora, sobre el portador humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen los gránulos no recubiertos con polvo.

<u>F6. Gránulos extruidos</u>	a)	b)	c)	d)
principio activo	0.1%	3%	5%	15%
lignosulfonato de sodio	1.5%	2%	3%	4%
carboximetilcelulosa	1.4%	2%	2%	2%
caolín	97.0%	93%	90%	79%

El principio activo se mezcla y muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extruye y después se seca en una corriente de aire.

<u>F7. Gránulos dispersables en agua</u>	a)	b)	c)	d)
principio activo	5%	10%	40%	90%
lignosulfonato de sodio	20%	20%	15%	7%
naftalenosulfonato de dibutilo	5%	5%	4%	2%
goma arábica	2%	1%	1%	1%
diatomita	20%	30%	5%	-
sulfato de sodio	-	4%	5%	-
caolín	48%	30%	30%	-

- 5 El principio activo se mezcla y muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extruye y después se seca con una corriente de aire.

<u>F8. Polvos</u>	a)	b)	c)
principio activo	0.1%	1%	5%
talco	39.9%	49%	35%
caolín	60.0%	50%	60%

Los polvos listos para usar se obtienen mezclando el principio activo con los portadores y moliendo la mezcla en un molino adecuado.

<u>F9. Concentrados en suspensión</u>	a)	b)	c)	d)
principio activo	3%	10%	25%	50%
propilenglicol	5%	5%	5%	5%
éter nonilfenol poliglicólico (15 mol de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
lignosulfonato de sodio	3%	3%	7%	6%
heteropolisacárido (xantano)	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%
1,2-bencisotiazolin-3-ona	0.1%	0.1%	0.1%	0.1%
emulsión de aceite de silicona	0.7%	0.7%	0.7%	0.7%
agua	88%	80%	60%	38%

- 10 Se crea una mezcla íntima del principio activo finamente molido y los adyuvantes para obtener un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden preparar suspensiones de cualquier concentración deseada por dilución con agua.

Usos herbicidas - cultivos de plantas útiles, malezas, tasas de aplicación y demás.

- 15 En un aspecto adicional, la presente invención proporciona un método para controlar malezas (p. ej., malezas

monocotiledóneas tales como malezas monocotiledóneas herbáceas) en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar un compuesto de fórmula (I) o una composición herbicida que comprende dicho compuesto a las malezas y/o a las plantas y/o en su emplazamiento.

5 En un aspecto adicional, la presente invención proporciona una composición herbicida, en particular, para su uso en un método para controlar malezas (p. ej., malezas monocotiledóneas tales como malezas monocotiledóneas herbáceas) en cultivos de plantas útiles, que comprende un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la presente (p. ej., una cantidad eficaz como herbicida de este) y un portador, diluyente y/o disolvente agroquímicamente aceptable.

10 En todos los aspectos de la invención, el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente (p. ej., cuando sea químicamente posible) como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

En una realización, la composición herbicida también comprende uno o más herbicidas adicionales, por ejemplo, como componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) y/o un protector. Remítase a la sección de combinaciones y mezclas de la presente para consultar más información sobre ejemplos de estos.

15 En todos los aspectos de la invención (p. ej., los métodos de empleo de la invención), los cultivos de plantas útiles, p. ej., sobre o en las que o en cuyo emplazamiento se pueden utilizar los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención, comprenden (p. ej., son), en particular, cereales (preferentemente cereales que no sean avena, en particular trigo, cebada, centeno y/o triticale), arroz, maíz, caña de azúcar, cultivos leguminosos [preferentemente cultivos de soja, maní y/o legumbres; más preferentemente soja; donde los cultivos de legumbres normalmente comprenden porotos secos (p. ej., poroto rojo o poroto blanco o poroto pinto que es *Phaseolus vulgaris*, o poroto mungo que es *Vigna radiata*), garbanzo, poroto tape (es decir, poroto de ojo negro, *Vigna unguiculata*), lentejas, habas secas y/o arvejas secas tales como arvejas del huerto], algodón, colza (en particular colza o canola oleaginosa), girasol, linaza, remolacha azucarera, remolacha forrajera, papa, hortalizas (preferiblemente hortalizas dicotiledóneas), lino, tabaco, cultivos de plantación (tales como coníferas, aceitunas y/u olivos, palmas oleaginosas, café o vides) y/o cultivos de frutas (en particular fruta dicotiledónea y/o de hoja ancha, y/o en particular pomos, frutas con hueso, arbustos frutales, cítricos, ananá, banana y/o frutilla).

25 Preferentemente, en todos los aspectos de la invención, los cultivos de plantas útiles, p. ej., sobre o en los que o en cuyo emplazamiento se pueden utilizar los compuestos o las composiciones de acuerdo con la invención, comprenden (p. ej., son) cereales (preferentemente cereales que no sean avena, más en particular trigo, cebada, centeno y/o triticale), arroz, maíz, caña de azúcar, cultivos leguminosos (preferentemente cultivos de soja, maní y/o legumbres, más preferentemente soja), algodón, colza (en particular colza o canola oleaginosa), girasol, linaza, remolacha azucarera, remolacha forrajera, papa y/o hortalizas (preferentemente hortalizas dicotiledóneas).

30 Aún más preferentemente, en todos los aspectos de la invención, los cultivos de plantas útiles, p. ej., sobre o en los cuales o en cuyo emplazamiento se pueden utilizar los compuestos o las composiciones de acuerdo con la invención, comprenden (p. ej., son) cereales que no sean avena, más en particular trigo, cebada, centeno y/o triticale.

35 Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO y/o HPPD, y/o 2,4-D o dicamba) como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o ingeniería genética. Los ejemplos de cultivos que se han modificado para que sean tolerantes, p. ej., a imidazolinonas (que son inhibidores de ALS), tales como imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo incluyen la colza de verano Clearfield® (canola) y/o el trigo Clearfield® y/o el arroz Clearfield® (todos ellos de BASF). 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 o soja tolerantes/resistentes a glufosinato o glifosato, en particular, aquellas comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady® o RoundupReady® 2 (ambas de Monsanto, ambas resistentes a glifosato) y LibertyLink® (de Bayer, resistente a glufosinato). También se ha publicado un variedad de arroz resistente a glufosinato (LibertyLink®).

40 Otros cultivos de plantas útiles incluyen la soja tolerante a 2,4-D, p. ej., la soja genéticamente modificada para que sea tolerante al herbicida 2,4-D o la soja tolerante a dicamba, p. ej., la soja genéticamente modificada para que sea tolerante al herbicida dicamba. Tales cultivos de soja tolerantes a dicamba o tolerantes a 2,4-D, también pueden ser tolerantes, en particular, a glifosato o glufosinato. Por ejemplo, los cultivos de plantas útiles incluyen sojas que contienen un rasgo de tolerancia a dicamba conjugado (combinado) con un rasgo de tolerancia a glifosato, de modo que estas sojas tienen tolerancia a los herbicidas glifosato y dicamba (p. ej., las sojas Genuity® Roundup Ready® 2 Xtend, actualmente en fase de desarrollo de Monsanto).

55 Se debe sobreentender que los cultivos también incluyen 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 y plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas. Algunos ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican resistencia a un insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (papas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y el material de las semillas de estas pueden ser resistentes a herbicidas y al mismo tiempo a insectos que se alimentan de ellas (eventos transgénicos "combinados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 activa como insecticida y al mismo tiempo ser tolerantes a glifosato. Se debe sobreentender que el término "cultivo" también incluye cultivos obtenidos como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o ingeniería genética que contienen los denominados rasgos externos (p. ej., un sabor, una estabilidad de almacenamiento y un contenido nutricional mejorados).

En todos los aspectos de la invención, las malezas, p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, pueden ser malezas monocotiledóneas (p. ej., herbáceas) y/o malezas dicotiledóneas. Preferentemente las malezas, p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, comprenden o son malezas monocotiledóneas, más preferentemente malezas monocotiledóneas herbáceas.

En todos los aspectos de la invención, normalmente, las malezas monocotiledóneas (preferentemente monocotiledóneas herbáceas), p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, comprenden (p. ej., son) malezas del género *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus* (un género de juncias), *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Eriochloa*, *Fimbristylis* (un género de juncias), *Juncus* (un género de juncos), *Leptochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Ottochloa*, *Panicum*, *Pennisetum*, *Phalaris*, *Poa*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus* (un género de juncias), *Setaria* y/o *Sorghum*; en particular: *Alopecurus myosuroides* (ALOMY, nombre en español "pasto negro"), *Apera spica-venti*, *Avena fatua* (AVEFA, nombre en español "avena silvestre"), *Avena ludoviciana*, *Avena sterilis*, *Avena sativa* (nombre en español "avena" (voluntaria)), *Brachiaria decumbens*, *Brachiaria plantaginea*, *Bromus tectorum*, *Digitaria horizontalis*, *Digitaria insularis*, *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (nombre en español "grama de agua común", ECHCG), *Echinochloa oryzoides*, *Echinochloa colona* o *colonom*, *Eleusine indica*, *Eriochloa villosa* (nombre en español "paspalo vellosa"), *Leptochloa chinensis*, *Leptochloa panicoides*, *Lolium perenne* (LOLPE, nombre en español "raigrás perenne"), *Lolium multiflorum* (LOLMU, nombre en español "raigrás italiano"), *Lolium persicum* (nombre en español "cizaña"), *Lolium rigidum*, *Panicum miliaceum* (nombre en español "millo salvaje"), *Phalaris minor*, *Phalaris paradoxa*, *Poa annua* (POAAN, nombre en español "pasto azul anual"), *Scirpus maritimus*, *Scirpus juncooides*, *Setaria viridis* (SETVI, nombre en español "cola de zorro verde"), *Setaria faberi* (SETFA, nombre en español "cola de zorro gigante"), *Setaria glauca*, *Setaria lutescens* (nombre en español "cola de zorro amarilla"), *Sorghum bicolor* y/o *Sorghum halepense* (nombre en español "hierba Johnson").

En una realización preferida de todos los aspectos de la invención, las malezas monocotiledóneas, p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, son malezas monocotiledóneas herbáceas; en cuyo caso comprenden (p. ej., son) habitualmente malezas del género *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Eriochloa*, *Leptochloa*, *Lolium*, *Ottochloa*, *Panicum*, *Pennisetum*, *Phalaris*, *Poa*, *Rottboellia*, *Setaria* y/o *Sorghum*.

En una realización particular de todos los aspectos de la invención, las malezas monocotiledóneas herbáceas, p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, son malezas herbáceas de "estaciones cálidas"; en cuyo caso comprenden (p. ej., son) habitualmente malezas del género *Brachiaria*, *Cenchrus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Eriochloa*, *Leptochloa*, *Ottochloa*, *Panicum*, *Pennisetum*, *Phalaris*, *Rottboellia*, *Setaria* y/o *Sorghum*.

En otra realización particular de todos los aspectos de la invención, las malezas monocotiledóneas herbáceas, p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, son malezas herbáceas de "estaciones frías"; en cuyo caso comprenden (p. ej., son) habitualmente malezas del género *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Bromus*, *Lolium* y/o *Poa*.

En cultivos de cereales que no sean avena, tales como el trigo y/o la cebada, se prefiere el control y/o la inhibición del crecimiento de malezas del género *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, especialmente *Avena fatua*, *Bromus*, *Lolium*, *Phalaris* y/o *Setaria*; en particular *Alopecurus*, *Avena* (especialmente *Avena fatua*), *Lolium* y/o *Setaria* (especialmente *Setaria viridis*, *Setaria lutescens*, *Setaria faberi* y/o *Setaria glauca*).

En una realización particular, en todos los aspectos de la invención, las malezas, p. ej., que se deseen controlar y/o cuyo crecimiento se desee inhibir, p. ej., mediante la aplicación de un compuesto de fórmula (I), pueden ser malezas monocotiledóneas herbáceas (por ejemplo, malezas del género *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Eriochloa*, *Leptochloa*, *Lolium*, *Ottochloa*, *Panicum*, *Pennisetum*, *Phalaris*, *Poa*, *Rottboellia*, *Setaria* y/o *Sorghum*),

- que son resistentes a uno o más herbicidas inhibidores de ACCasa (ACCasa = acetil-coenzima A carboxilasa) seleccionados del grupo constituido por pinoxadén, clodinafop-propargilo, fenoxaprop-P-etilo, diclofop-metilo, fluazifop-P-butilo, haloxifop-P-metilo, quizalofop-P-etilo, propaquizafop, cihalofop-butilo, cletodim, setoxidim, cicloxidim, tralkoxidim y butroxidim;

- y/o que son resistentes a glifosato;

- y/o que son resistentes a uno o más herbicidas inhibidores de ALS (ALS = acetolactato-sintasa), tales como uno o más herbicidas de tipo sulfonilurea (p. ej., yodosulfurón-metilo, mesosulfurón-metilo, tribenurón-metilo, triasulfurón, prosulfurón, sulfosulfurón, pirazosulfurón-etilo, bensulfurón-metilo, nicosulfurón, flazasulfurón, iofensulfurón, metsulfurón-metilo, o cualquier otro herbicida de tipo sulfonilurea descrito en el Manual de pesticidas, 15.^a edición, 2009, ed. C.D.S. Tomlin, Consejo Británico de Protección de Cultivos) y/o uno o más herbicidas de tipo triazolpirimidina (p. ej., florasulam, piroxsulam o penoxsulam) y/o uno o más herbicidas de tipo pirimidinil(tio u oxi)benzoato (p. ej., bispiribac-sodio o piriftalid) y/o uno o más herbicidas de tipo sulfonilaminocarboniltriazolinona (p. ej., tiencarbazona-metilo, propoxicarbazona-sodio o flucarbazona-sodio) y/o uno o más herbicidas de tipo imidazolinona (p. ej., imazamox).

Tales malezas herbáceas resistentes (en particular resistentes a inhibidores de ACCasa, resistentes a glifosato y/o resistentes a inhibidores de ALS) pueden comprender más particularmente *Alopecurus myosuroides*, *Apera spica-venti*, *Avena fatua*, *Avena sterilis*, *Brachiaria decumbens*, *Brachiaria plantaginea*, *Digitaria horizontalis*, *Digitaria insularis*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa colona*, *Echinochloa crus-galli*, *Eleusine indica*, *Lolium multiflorum*, *Lolium rigidum*, *Lolium perenne*, *Phalaris minor*, *Phalaris paradoxa*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, *Setaria glauca* y/o *Sorghum halepense*.

En una realización incluso más particular de la invención, el compuesto de fórmula (I) se puede aplicar a malezas monocotiledóneas herbáceas (p. ej., seleccionadas de una de las listas de malezas herbáceas mencionadas anteriormente):

(a1) que son resistentes a uno o más herbicidas inhibidores de ACCasa (p. ej., seleccionados de la lista de herbicidas inhibidores de ACCasa mencionada anteriormente) al menos parcialmente por mutación (p. ej., sustitución) de uno o más aminoácidos en el sitio diana de la ACCasa en la maleza (p. ej., remítase a S.B. Powles y Qin Yu, "Evolution in Action: Plants Resistant to Herbicides", *Annu. Rev. Plant Biol.*, 2010, 61, págs. 317-347, p. ej., remítase a las págs. 325-327 de este artículo, en particular la Tabla 3, que se incorpora a la presente por referencia, para consultar ejemplos de este tipo de malezas resistentes y/o sustituciones aminoacídicas); y/o

(a2) que son resistentes a glifosato al menos parcialmente por mutación (p. ej., sustitución) de uno o más aminoácidos en el sitio diana de la EPSPS en la maleza sobre la que actúa el glifosato (p. ej., remítase al artículo mencionado anteriormente de S.B. Powles y Qin Yu, págs. 327-329); y/o

(a3) que son resistentes a uno o más herbicidas inhibidores de ALS (p. ej., seleccionados de la lista de herbicidas inhibidores de ALS mencionada anteriormente) al menos parcialmente por mutación (p. ej., sustitución) de uno o más aminoácidos en el sitio diana de la ALS en la maleza (p. ej., remítase a S.B. Powles y Qin Yu, "Evolution in Action: Plants Resistant to Herbicides", *Annu. Rev. Plant Biol.*, 2010, 61, págs. 317-347, p. ej., remítase a las págs. 322-324 de este artículo, en particular la Tabla 2, para consultar ejemplos de este tipo de malezas resistentes y/o sustituciones aminoacídicas); y/o

(b) que son resistentes a: uno o más herbicidas inhibidores de ACCasa (p. ej., seleccionados de la lista mencionada anteriormente), y/o glifosato, y/o uno o más herbicidas inhibidores de ALS (p. ej., seleccionados de la lista mencionada anteriormente); al menos parcialmente por resistencia al herbicida de tipo metabólica, p. ej., al menos parcialmente por el metabolismo del herbicida mediado por el citocromo P450 (p. ej., remítase a S.B. Powles y Qin Yu, "Evolution in Action: Plants Resistant to Herbicides", *Annu. Rev. Plant Biol.*, 2010, 61, págs. 317-347, p. ej., remítase a la Tabla 4 en la página 328 de dicho artículo, para consultar ejemplos de este tipo de malezas resistentes).

Normalmente, las malezas dicotiledóneas, p. ej., que se deseen controlar, comprenden (p. ej., son) *Abutilon*, *Amaranthus*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Galium*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Nasturtium*, *Polygonum*, *Sida*, *Sinapsis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Viola*, *Veronica* y/o *Xanthium*.

Se debe sobreentender que las áreas cultivadas y/o el emplazamiento (p. ej., de malezas y/o de cultivos de plantas útiles) incluyen terrenos en los que las plantas de cultivo ya se han cultivado así como también terrenos destinados al cultivo de tales plantas de cultivo.

En todos los aspectos de la invención, la tasa de aplicación (normalmente a las malezas y/o los cultivos de plantas útiles y/o a su emplazamiento) del compuesto de fórmula (I) (que opcionalmente puede tratarse de una de sus sales agroquímicamente aceptables) es generalmente de 1 a 2000 g del compuesto de fórmula (I) por hectárea (ha) (medido como el compuesto libre, es decir, excluyendo el peso de cualquier contraión o contraiones asociados que formen una sal), en particular de 5 a 500 g/ha, preferentemente de 10 a 400 g/ha, del compuesto de fórmula (I) (medido como el compuesto exento de sal, es decir, excluyendo el peso de cualquier contraión o contraiones asociados que formen una sal).

En todos los aspectos de la invención, el compuesto de fórmula (I) puede aplicarse (normalmente a las malezas y/o los cultivos de plantas útiles y/o a su emplazamiento) antes y/o después de la emergencia, pero preferentemente se aplica después de la emergencia.

Combinaciones y mezclas

En un aspecto adicional, la presente invención proporciona una composición herbicida, p. ej., para su uso en un método para controlar malezas (p. ej., monocotiledóneas tales como malezas herbáceas) en cultivos de plantas útiles, que comprende un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en la presente (p. ej., una cantidad eficaz como herbicida de este) y un portador, diluyente y/o disolvente agroquímicamente aceptable, y que comprende también uno o más herbicidas adicionales y/o un protector.

En todos los aspectos de la invención, el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente (p. ej., cuando sea químicamente posible) como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

A continuación se presentan ejemplos de estas mezclas/ composiciones, que comprenden uno o más herbicidas adicionales y/o un protector.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se pueden utilizar combinados con uno o más herbicidas adicionales, p. ej., como componente o componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I). Preferentemente, en estas mezclas (en particular en las mezclas específicas que se describen a continuación en la presente), el compuesto de fórmula (I) es uno de los compuestos específicos descritos en la presente, p. ej., más adelante en la presente (en particular, cualquiera de los compuestos A1-A99, o el compuesto A100 o A101, o cualquiera de los compuestos A102-A108, o cualquiera de los compuestos A109-A211, o cualquiera de los compuestos P1-P30), presente como compuesto libre y/o como una de sus sales agroquímicamente aceptable.

En particular, se describen particularmente las siguientes mezclas del compuesto de fórmula (I) con uno o más herbicidas adicionales:

compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfenosodio, compuesto de fórmula I + aclonifeno, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopirralid, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de fórmula I + anilofós, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamid, compuesto de fórmula I + benazolina, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzofendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafós, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + borax, compuesto de fórmula I + bromacilo, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + heptanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula I + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula I + heptanoato de bromoxinilo + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + butamifós, compuesto de fórmula I + butralín, compuesto de fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + clorflurenol, compuesto de fórmula I + clorflurenol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + clorimurón, compuesto de fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + clortal, compuesto de fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralid, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 2,4-D-dimetilamonio, compuesto de fórmula I + 2,4-D-2-etilhexilo, compuesto de fórmula I + una sal colínica de 2,4-D (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1), compuesto de fórmula I + 2,4-D + glifosato, compuesto de fórmula I + 2,4-D-dimetilamonio + glifosato, compuesto de fórmula I + 2,4-D-2-etilhexilo + glifosato, compuesto de fórmula I + una sal colínica de 2,4-D + glifosato (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1), compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + dicamba-dimetilamonio, compuesto de fórmula I + dicamba-potasio, compuesto de fórmula I + dicamba-sodio, compuesto de fórmula I + dicamba-

diglicolamina, compuesto de fórmula I + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1), compuesto de fórmula I + dicamba + glifosato, compuesto de fórmula I + dicamba-dimetilamonio + glifosato, compuesto de fórmula I + dicamba-potasio + glifosato, compuesto de fórmula I + dicamba-sodio + glifosato, compuesto de fórmula I + dicamba-diglicolamina + glifosato, compuesto de fórmula I + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba + glifosato, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + *orto*-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + *para*-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclorprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenicán, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrina, compuesto de fórmula I + dimetenamid, compuesto de fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de fórmula I + dimetipina, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarsínico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamid, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diurón, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfluralina, compuesto de fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifeno, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula I + etobenzanid, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-etilo, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fenoxasulfona (N.º de Reg. CAS 639826-16-7), compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop-P, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloralina, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofeno, compuesto de fórmula I + fluoroglicofeno-etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + fluorocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + fluroxipir-meptilo, compuesto de fórmula I + fluroxipir-butometilo, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula I + fomesafeno, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amonio, compuesto de fórmula I + glufosinato-P, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + glifosato-diamonio, compuesto de fórmula I + glifosato-isopropilamonio, compuesto de fórmula I + glifosato-potasio, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula (I) + haloxifop-metilo, compuesto de fórmula (I) + haloxifop-P-metilo, compuesto de fórmula I + HC-252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquina, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofán, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + ioxinilo, compuesto de fórmula I + ipfencarbazona (N.º de Reg. CAS 212201-70-2), compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + isourón, compuesto de fórmula I + isoxabeno, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofeno, compuesto de fórmula I + lenacilo, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metazosulfurón (NC-620, N.º de Reg. CAS 868680-84-6), compuesto de fórmula I + metabenzotiazurón, compuesto de fórmula I + ácido metilarsínico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S-metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalina, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazón, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfenol, compuesto de fórmula I + paraquat,

compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamid, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + piperofós, compuesto de fórmula I + arsenito de potasio, compuesto de fórmula I + azida de potasio, compuesto de fórmula I + pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluzol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propirisulfurón (TH-547, N.º de Reg. CAS 570415-88-2), compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraconilo, compuesto de fórmula I + piraflufeno, compuesto de fórmula I + piraflufeno-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifeno, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piriftalid, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfán, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quinclorac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quinoalamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-etilo, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + quizalofop-P-etilo, compuesto de fórmula I + quizalofop-P-tefurilo, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito de sodio, compuesto de fórmula I + azida de sodio, compuesto de fórmula I + clorato de sodio, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio, compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacilo, compuesto de fórmula I + terbumetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + trialato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético (N.º de Reg. CAS 353292-31-6), compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofen-3-carboxílico (BAY636), compuesto de fórmula I + BAY747 (N.º de Reg. CAS 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topamezona (N.º de Reg. CAS 210631-68-8), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (que es biciclopirona, N.º de Reg. CAS 352010-68-5), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona, compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-ciclopropil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2H-piran-3,5(4H,6H)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P8 descrito en las páginas 31-32 y 35-36 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-13 descrito en las páginas 4, 5, 7 y 11 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-ciclopropilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2H-piran-3,5(4H,6H)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P9 descrito en las páginas 36-37 y 40-41 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-12 descrito en la página 10 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-etil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2H-piran-3,5(4H,6H)-diona (que es el compuesto A-66 descrito en la página 95 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-4 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2H-piran-3,5(4H,6H)-diona (que es el compuesto A-45 descrito en la página 93 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto del Ejemplo P10 descrito en las páginas 41 y 45 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-7 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-5-(metoxicarbonilo)-2,2,6,6-tetrametil-2H-piran-3(6H)-ona (que es el compuesto D-26 descrito en la página 231 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-9 descrito en la página 8 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059676 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto cloquintocet-mexilo como protector), compuesto de fórmula (I) + uno de los

compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059680 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto cloquintocet-mexilo u otro protector), y compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059671 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto con un protector), estas partes de dicho documento se incorporan a la presente por referencia, compuesto de fórmula I + halauxifeno (que es el ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxílico, N.º de Reg. CAS 943832-60-8), compuesto de fórmula I + halauxifeno-metilo (que es el 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo, N.º de Reg. CAS 943831-98-9), compuesto de fórmula I + aminociclopiraclor (que es el ácido 6-amino-5-cloro-2-ciclopropilpirimidin-4-carboxílico, N.º de Reg. CAS 858956-08-8), compuesto de fórmula I + aminociclopiraclor-metilo (que es el 6-amino-5-cloro-2-ciclopropilpirimidin-4-carboxilato de metilo, N.º de Reg. CAS 858954-83-3), compuesto de fórmula I + aminociclopiraclor-potasio (que es el 6-amino-5-cloro-2-ciclopropilpirimidin-4-carboxilato de potasio, N.º de Reg. CAS 858956-35-1), compuesto de fórmula I + saflufenacilo (que es la *N'*-{2-cloro-4-fluoro-5-[1,2,3,6-tetrahidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]benzoil}-*N*-isopropil-*N*-metilsulfamida, N.º de Reg. CAS 372137-35-4), compuesto de fórmula I + iofensulfurón (que es la 1-(2-yodofenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea, N.º de Reg. CAS 1144097-22-2), compuesto de fórmula I + iofensulfurón-sodio (que es el *N*-(2-yodofenilsulfonil)-*N'*-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)carbamidato de sodio, N.º de Reg. CAS 1144097-30-2), compuesto de fórmula I + clacifós (que es el [(1*RS*)-1-(2,4-diclorofenoxiacetoxi)etil]fosfonato de dimetilo, denominado también lvxiancaolín o lüxiancaolín, CAS Reg. N.º 215655-76-8), compuesto de fórmula I + ciclopirimorato (que es el morfolin-4-carboxilato de 6-cloro-3-(2-ciclopropil-6-metilfenoxi)piridazin-4-ilo, N.º de Reg. CAS 499231-24-2), o compuesto de fórmula I + triafamona (que es la *N*-[2-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)carbonil]-6-fluorofenil]-*N*-metil-1,1-difluorometanosulfonamida, N.º de Reg. CAS 874195-61-6).

Los componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) están opcionalmente en forma de un éster (en particular un éster agroquímicamente aceptable) o una sal (en particular una sal agroquímicamente aceptable) de este (p. ej., cuando sea químicamente posible). Los componentes de la mezcla mencionados anteriormente para el compuesto de fórmula (I), en general se mencionan, p. ej., en el Manual de pesticidas, 15.ª edición, 2009, ed. C.D.S. Tomlin, Consejo Británico de Protección de Cultivos.

En la memoria descriptiva de la presente patente, la expresión "N.º de Reg. CAS" o "NR CAS" se refiere al número de registro en el *Chemical Abstracts Service* del compuesto indicado.

Para las aplicaciones en los cereales, se prefieren las siguientes mezclas: compuesto de fórmula I + aclonifeno, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopirialid, compuesto de fórmula I + beflubutamid, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + heptanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula I + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula I + heptanoato de bromoxinilo + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clopiralid, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 2,4-D-dimetilamonio, compuesto de fórmula I + 2,4-D-2-etilhexilo, compuesto de fórmula (I) + una sal colínica de 2,4-D (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1), compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + dicamba-dimetilamonio, compuesto de fórmula I + dicamba-potasio, compuesto de fórmula I + dicamba-sodio, compuesto de fórmula I + dicamba-diglicolamina, compuesto de fórmula (I) + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1), compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenicán, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-etilo, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + fluroxipir-meptilo, compuesto de fórmula I + fluroxipir-butometilo, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + ioxinilo, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + pirasulfotol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piroxasulfona (KIH-485), compuesto de fórmula I + piroxsulam, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón,

compuesto de fórmula I + tembotriona, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tiencarbazona, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + topamezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + trialato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + trinexapac-etilo y compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (que es biciclopirona, N.º de Reg. CAS 352010-68-5), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059676 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto cloquintocet-mexilo como protector), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059680 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto cloquintocet-mexilo u otro protector), compuesto de fórmula I + halauxifeno (que es el ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxílico, N.º de Reg. CAS 943832-60-8), compuesto de fórmula I + halauxifeno-metilo (que es el 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo, N.º de Reg. CAS 943831-98-9), compuesto de fórmula I + iofensulfurón (que es la 1-(2-yodofenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea, N.º de Reg. CAS 1144097-22-2), o compuesto de fórmula I + iofensulfurón-sodio (que es el *N*-(2-yodofenilsulfonil)-*N'*-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)carbamidato de sodio, N.º de Reg. CAS 1144097-30-2);

donde los componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) pueden estar opcionalmente en forma de un éster (en particular un éster agroquímicamente aceptable) o una sal (en particular una sal agroquímicamente aceptable) de este (p. ej., cuando sea químicamente posible).

Para las aplicaciones en los cereales, es más preferida una mezcla que comprenda: un compuesto de fórmula (I) + amidosulfurón, compuesto de fórmula (I) + aminopiridid, compuesto de fórmula (I) + beflubutamid, compuesto de fórmula (I) + bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + heptanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + heptanoato de bromoxinilo + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula (I) + clorotolurón, compuesto de fórmula (I) + clorsulfurón, compuesto de fórmula (I) + clodinafop, compuesto de fórmula (I) + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula (I) + clopiralid, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-dimetilamonio, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-2-etilhexilo, compuesto de fórmula (I) + una sal colínica de 2,4-D (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1), compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + dicamba-dimetilamonio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-potasio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-sodio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-diglicolamina, compuesto de fórmula (I) + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1), compuesto de fórmula (I) + difenzoquat, compuesto de fórmula (I) + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula (I) + diflufenicán, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de fórmula (I) + flucarbazona, compuesto de fórmula (I) + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula (I) + flufenacet, compuesto de fórmula (I) + flupirsulfurón, compuesto de fórmula (I) + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula (I) + fluroxipir, compuesto de fórmula I + fluroxipir-meptilo, compuesto de fórmula I + fluroxipir-butometilo, compuesto de fórmula (I) + flurtamona, compuesto de fórmula (I) + yodosulfurón, compuesto de fórmula (I) + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mesosulfurón, compuesto de fórmula (I) + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + picolinafeno, compuesto de fórmula (I) + pinoxadeno, compuesto de fórmula (I) + prosulfocarb, compuesto de fórmula (I) + pirasulfotol, compuesto de fórmula (I) + piroxasulfona (KH-485), compuesto de fórmula (I) + piroxsulam, compuesto de fórmula (I) + sulfosulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + topamezona, compuesto de fórmula (I) + tralkoxidim, compuesto de fórmula (I) + triasulfurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + trifluralina, compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo, compuesto de fórmula (I) + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (que es biciclopirona, N.º de Reg. CAS 352010-68-5), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059676 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto cloquintocet-mexilo como protector), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059680 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto cloquintocet-mexilo u otro protector), compuesto de fórmula I + halauxifeno (que es el ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxílico, N.º de Reg. CAS 943832-60-8), compuesto de fórmula I + halauxifeno-metilo (que es el 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo, N.º de Reg. CAS 943831-98-9), compuesto de fórmula I + iofensulfurón (que es la 1-(2-yodofenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea, N.º de Reg. CAS 1144097-22-2), o compuesto de fórmula I + iofensulfurón-sodio (que es el *N*-(2-yodofenilsulfonil)-*N'*-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)carbamidato de sodio, N.º de Reg. CAS 1144097-30-2);

donde los componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) pueden estar opcionalmente en forma de un éster (en particular un éster agroquímicamente aceptable) o una sal (en particular una sal agroquímicamente aceptable) de este (p. ej., cuando sea químicamente posible).

Para las aplicaciones en el arroz, se prefieren las siguientes mezclas: compuesto de fórmula (I) + azimsulfurón, compuesto de fórmula (I) + bensulfurón, compuesto de fórmula (I) + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + benzobiciclón, compuesto de fórmula (I) + benzofenap, compuesto de fórmula (I) + bispiribac, compuesto de fórmula (I) + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula (I) + butaclor, compuesto de fórmula (I) + cafenstrol, compuesto de fórmula (I) + cinosulfurón, compuesto de fórmula (I) + clomazona, compuesto de fórmula (I) + clomeprop, compuesto de fórmula (I) + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula (I) + cihalofop, compuesto de fórmula (I) + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-dimetilamonio, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-2-etilhexilo, compuesto de fórmula (I) + una sal colínica de 2,4-D (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1), compuesto de fórmula (I) + daimurón, compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + dicamba-dimetilamonio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-potasio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-sodio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-diglicolamina, compuesto de fórmula (I) + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1), compuesto de fórmula (I) + diquat, compuesto de fórmula (I) + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula (I) + esprocarb, compuesto de fórmula (I) + etoxisulfurón, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-etilo, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + fenoxasulfona (N.º de Reg. CAS 639826-16-7), compuesto de fórmula (I) + fentrazamida, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de fórmula (I) + glufosinato-amonio, compuesto de fórmula (I) + glifosato, compuesto de fórmula (I) + glifosato-diamonio, compuesto de fórmula (I) + glifosato-isopropilamonio, compuesto de fórmula (I) + glifosato-potasio, compuesto de fórmula (I) + halosulfurón, compuesto de fórmula (I) + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + imazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + ipfencarbazona (N.º de Reg. CAS 212201-70-2), compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mfenacet, compuesto de fórmula (I) + mesotriona, compuesto de fórmula (I) + metamifop, compuesto de fórmula (I) + metazosulfurón (NC-620, N.º de Reg. CAS 868680-84-6), compuesto de fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + glifosato de *n*-metilo, compuesto de fórmula (I) + ortosulfamurón, compuesto de fórmula (I) + orizalina, compuesto de fórmula (I) + oxadiargilo, compuesto de fórmula (I) + oxadiazón, compuesto de fórmula (I) + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + penoxsulam, compuesto de fórmula (I) + pretilaclor, compuesto de fórmula (I) + profoxidim, compuesto de fórmula (I) + propanilo, compuesto de fórmula (I) + propirisulfurón (TH-547, N.º de Reg. CAS 570415-88-2), compuesto de fórmula (I) + pirazolinato, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula (I) + pirazoxifeno, compuesto de fórmula (I) + piribenzoxim, compuesto de fórmula (I) + piritalid, compuesto de fórmula (I) + piriminobac, compuesto de fórmula (I) + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula (I) + pirimisulfán, compuesto de fórmula (I) + quinclorac, compuesto de fórmula (I) + tefuriltriona, compuesto de fórmula (I) + triasulfurón y compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo, compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-ciclopropil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P8 descrito en las páginas 31-32 y 35-36 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-13 descrito en las páginas 4, 5, 7 y 11 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-ciclopropilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P9 descrito en las páginas 36-37 y 40-41 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-12 descrito en la página 10 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-etil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto A-66 descrito en la página 95 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-4 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto A-45 descrito en la página 93 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto del Ejemplo P10 descrito en las páginas 41 y 45 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-7 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-5-(metoxicarboniloxi)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3(6*H*)-ona (que es el compuesto D-26 descrito en la página 231 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-9 descrito en la página 8 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059671 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto con un protector), compuesto de fórmula (I) + halauxifeno (que es el ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxílico, N.º de Reg. CAS 943832-60-8), compuesto de fórmula (I) + halauxifeno-metilo (que es el 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo, N.º de Reg. CAS 943831-98-9), compuesto de fórmula (I) + iofensulfurón (que es la 1-(2-yodofenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea, N.º de Reg. CAS 1144097-22-2), compuesto de fórmula (I) + iofensulfurón-sodio (que es el *N*-(2-yodofenilsulfonil)-*N'*-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)carbamidato de sodio, N.º de Reg. CAS 1144097-30-2), o compuesto de fórmula (I) + triafamona (que es la *N*-[2-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)carbonil]-6-fluorofenil]-*N*-metil-1,1-difluorometanosulfonamida, N.º de Reg. CAS 874195-61-6);

donde los componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) pueden estar opcionalmente en forma de un éster (en particular un éster agroquímicamente aceptable) o una sal (en particular una sal agroquímicamente aceptable) de este (p. ej., cuando sea químicamente posible).

Para las aplicaciones en el arroz, es más preferida una mezcla que comprenda: un compuesto de fórmula (I) +

azimsulfurón, compuesto de fórmula (I) + bensusulfurón, compuesto de fórmula (I) + bensusulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + benzobiciclón, compuesto de fórmula (I) + benzofenap, compuesto de fórmula (I) + bispiribac, compuesto de fórmula (I) + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula (I) + clomazona, compuesto de fórmula (I) + clomeprop, compuesto de fórmula (I) + cihalofop, compuesto de fórmula (I) + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-dimetilamonio, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-2-etilhexilo, compuesto de fórmula (I) + una sal colínica de 2,4-D (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1), compuesto de fórmula (I) + daimurón, compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + dicamba-dimetilamonio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-potasio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-sodio, compuesto de fórmula (I) + dicamba-diglicolamina, compuesto de fórmula (I) + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1), compuesto de fórmula (I) + esprocarb, compuesto de fórmula (I) + etoxisulfurón, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + fenoxasulfona (N.º de Reg. CAS 639826-16-7), compuesto de fórmula (I) + fentrazamida, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de fórmula (I) + halosulfurón, compuesto de fórmula (I) + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + imazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + ipfencarbazona (N.º de Reg. CAS 212201-70-2), compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mefenacet, compuesto de fórmula (I) + mesotriona, compuesto de fórmula (I) + metazosulfurón (NC-620, N.º de Reg. CAS 868680-84-6), compuesto de fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + ortosulfamurón, compuesto de fórmula (I) + oxadiargilo, compuesto de fórmula (I) + oxadiazón, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + penoxsulam, compuesto de fórmula (I) + pretilaclor, compuesto de fórmula (I) + propirisulfurón (TH-547, N.º de Reg. CAS 570415-88-2), compuesto de fórmula (I) + pirazolinato, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula (I) + pirazoxifeno, compuesto de fórmula (I) + piribenzoxim, compuesto de fórmula (I) + pirifitalid, compuesto de fórmula (I) + piriminobac, compuesto de fórmula (I) + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula (I) + pirimisulfán, compuesto de fórmula (I) + quinclorac, compuesto de fórmula (I) + tefuriltriona, compuesto de fórmula (I) + triasulfurón y compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo, compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-ciclopropil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P8 descrito en las páginas 31-32 y 35-36 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-13 descrito en las páginas 4, 5, 7 y 11 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-ciclopropilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P9 descrito en las páginas 36-37 y 40-41 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-12 descrito en la página 10 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-etil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto A-66 descrito en la página 95 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-4 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto A-45 descrito en la página 93 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto del Ejemplo P10 descrito en las páginas 41 y 45 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-7 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-5-(metoxicarbonilo)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3(6*H*)-ona (que es el compuesto D-26 descrito en la página 231 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-9 descrito en la página 8 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + uno de los compuestos herbicidas específicos descritos en el documento WO 2010/059671 (Dow, p. ej., tal como se define en uno de los ejemplos de dicho documento y/o, p. ej., puede ser junto con un protector), compuesto de fórmula (I) + halauxifeno (que es el ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxílico, N.º de Reg. CAS 943832-60-8), compuesto de fórmula (I) + halauxifeno-metilo (que es el 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo, N.º de Reg. CAS 943831-98-9), compuesto de fórmula (I) + iofensulfurón (que es la 1-(2-yodofenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea, N.º de Reg. CAS 1144097-22-2), compuesto de fórmula (I) + iofensulfurón-sodio (que es el *N*-(2-yodofenilsulfonil)-*N'*-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)carbamidato de sodio, N.º de Reg. CAS 1144097-30-2), o compuesto de fórmula (I) + triafamona (que es la *N*-[2-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)carbonil]-6-fluorofenil]-*N*-metil-1,1-difluorometanosulfonamida, N.º de Reg. CAS 874195-61-6);

donde los componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) pueden estar opcionalmente en forma de un éster (en particular un éster agroquímicamente aceptable) o una sal (en particular una sal agroquímicamente aceptable) de este (p. ej., cuando sea químicamente posible).

Para las aplicaciones en la soja, se prefieren las siguientes mezclas:

compuesto de fórmula (I) + acifluorfeno, compuesto de fórmula (I) + acifluorfeno-sodio, compuesto de fórmula (I) + ametrina, compuesto de fórmula (I) + atrazina, compuesto de fórmula (I) + bentazona, compuesto de fórmula (I) + biciclopirona, compuesto de fórmula (I) + bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + heptanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + heptanoato de bromoxinilo + octanoato de bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula (I) + cloransulam, compuesto de fórmula (I) + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula (I) + clorimurón, compuesto de fórmula (I) + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula (I) + cletodim, compuesto de fórmula

(I) + clomazona, compuesto de fórmula (I) + cianazina, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-dimetilamonio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-etilhexil (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula I + una sal colínica de 2,4-D (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1) (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + 2,4-D + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-dimetilamonio + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + 2,4-D-2-etilhexilo + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + una sal colínica de 2,4-D + glifosato (remítase a, p. ej., los Ejemplos 2 y 3 del documento WO2010/123871A1) (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a 2,4-D y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-dimetilamonio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-potasio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-sodio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-diglicolamina (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1) (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-dimetilamonio + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-potasio + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-sodio + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + dicamba-diglicolamina + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + una sal *N,N*-bis-[aminopropil]metilamínica de dicamba + glifosato (remítase a, p. ej., el documento US2012/0184434A1) (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a dicamba y/o tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + diclosulam, compuesto de fórmula (I) + dimetenamid, compuesto de fórmula (I) + dimetenamid-P, compuesto de fórmula (I) + diquat, compuesto de fórmula (I) + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula (I) + diurón, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-etilo, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + fluazifop, compuesto de fórmula (I) + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula (I) + fluazifop-P, compuesto de fórmula (I) + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula (I) + flufenacet, compuesto de fórmula (I) + flumetsulam, compuesto de fórmula (I) + flumioxazina, compuesto de fórmula (I) + flutiacet, compuesto de fórmula (I) + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula (I) + fomesafeno, compuesto de fórmula (I) + glufosinato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a glufosinato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + glufosinato-amonio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a glufosinato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + glifosato (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + glifosato-diamonio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + glifosato-isopropilamonio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + glifosato-potasio (especialmente para las aplicaciones a la soja tolerante a glifosato, p. ej., genéticamente modificada), compuesto de fórmula (I) + imazetapir, compuesto de fórmula (I) + lactofeno, compuesto de fórmula (I) + mesotriona, compuesto de fórmula (I) + metolaclor, compuesto de fórmula (I) + S-metolaclor, compuesto de fórmula (I) + metribuzina, compuesto de fórmula (I) + oxifluorfen, compuesto de fórmula (I) + paraquat, compuesto de fórmula (I) + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + piroxasulfona, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-etilo, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + quizalofop-P-etilo, compuesto de fórmula I + quizalofop-P-tefurilo, compuesto de fórmula (I) + saflufenacilo, compuesto de fórmula (I) + setoxidim, compuesto de fórmula (I) + sulfentrazona, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + tribenurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + trifluralina, compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-ciclopropil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P8 descrito en las páginas 31-32 y 35-36 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-13 descrito en las páginas 4, 5, 7 y 11 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-ciclopropilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto del Ejemplo P9 descrito en las páginas 36-37 y 40-41 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-12 descrito en la página 10 del documento WO 2011/073616 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(4'-cloro-4-etil-2'-fluorobifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto A-66 descrito en la página 95 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-4 descrito en la página 7 del

documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3,5(4*H*,6*H*)-diona (que es el compuesto A-45 descrito en la página 93 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto del Ejemplo P10 descrito en las páginas 41 y 45 del documento WO 2010/136431 A9 (Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-7 descrito en la página 7 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited), compuesto de fórmula (I) + 4-(2',4'-dicloro-4-etilbifenil-3-il)-5-(metoxicarbonilo)-2,2,6,6-tetrametil-2*H*-piran-3(6*H*)-ona (que es el compuesto D-26 descrito en la página 231 del documento WO 2008/071405 A1 (Syngenta Participations AG y Syngenta Limited), y que también es el compuesto A-9 descrito en la página 8 del documento WO 2011/073615 A2 (Syngenta Limited);

10 donde los componentes de la mezcla para el compuesto de fórmula (I) pueden estar opcionalmente en forma de un éster (en particular un éster agroquímicamente aceptable) o una sal (en particular una sal agroquímicamente aceptable) de este (p. ej., cuando sea químicamente posible).

15 En las composiciones o mezclas mencionadas anteriormente que comprenden un compuesto de fórmula (I) (en particular, uno de los compuestos específicos descritos en la presente, p. ej., cualquiera de los compuestos A1-A99, o el compuesto A100 o A101, o cualquiera de los compuestos A102-A108, o cualquiera de los compuestos A109-A211, o cualquiera de los compuestos P1-P30, presente en forma de compuesto libre y/o como una de sus sales agroquímicamente aceptables) y uno o más herbicidas adicionales, y la relación ponderal del compuesto de fórmula (I) respecto a cada herbicida adicional puede variar dentro de un rango amplio y es, normalmente, de 300:1 a 1:500, especialmente de 150:1 a 1:200, más especialmente de 100:1 a 1:100, incluso más especialmente de 30:1 a 1:30. Normalmente, estas relaciones ponderales se miden como el compuesto o los compuestos libres, es decir, excluyendo el peso de cualquier contraión o contraiones asociados que formen una sal.

20 Como alternativa o además, en las composiciones herbicidas, los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también se pueden utilizar combinados con un protector. Preferentemente, en estas mezclas, el compuesto de fórmula I es uno de los compuestos específicos descritos en la presente, p. ej., más adelante en la presente (en particular, cualquiera de los compuestos A1-A99, o el compuesto A100 o A101, o cualquiera de los compuestos A102-A108, o cualquiera de los compuestos A109-A211, o cualquiera de los compuestos P1-P30), presente como compuesto libre y/o como una de sus sales agroquímicamente aceptables. Se tienen en cuenta especialmente las siguientes mezclas con protectores:

30 compuesto de fórmula I + cloquintocet-mexilo, compuesto de fórmula I + el ácido cloquintocet o una de sus sales agroquímicamente aceptables, compuesto de fórmula I + fenclorazol-etilo, compuesto de fórmula I + el ácido fenclorazol o una de sus sales agroquímicamente aceptables, compuesto de fórmula I + mefenpir-dietilo, compuesto de fórmula I + el diácido mefenpir, compuesto de fórmula I + isoxadifeno-etilo, compuesto de fórmula I + el ácido isoxadifeno, compuesto de fórmula I + furilazol, compuesto de fórmula I + isómero *R* de furilazol, compuesto de fórmula (I) + *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, compuesto de fórmula I + benoxacor, compuesto de fórmula I + diclormid, compuesto de fórmula I + AD-67, compuesto de fórmula I + oxabetrinilo, compuesto de fórmula I + ciometrinilo, compuesto de fórmula I + isómero *Z* de ciometrinilo, compuesto de fórmula I + fenclorim, compuesto de fórmula I + ciprosulfamida, compuesto de fórmula I + anhídrido naftálico, compuesto de fórmula I + flurazol, compuesto de fórmula I + CL 304,415, compuesto de fórmula I + diclisona, compuesto de fórmula I + fluxofenim, compuesto de fórmula I + DKA-24, compuesto de fórmula I + R-29148 y compuesto de fórmula I + PPG-1292.

40 Los protectores y herbicidas mencionados anteriormente se describen, por ejemplo, en el Manual de pesticidas, 14.^a edición, Consejo Británico de Protección de Cultivos, 2006; o el Manual de pesticidas, 15.^a edición, 2009, ed. C.D.S. Tomlin, Consejo Británico de Protección de Cultivos. R-29148 se describe, por ejemplo, en P.B. Goldsbrough *et al.*, *Plant Physiology*, (2002), Vol. 130, págs. 1497-1505 y las referencias de dicho documento. PPG-1292 se presenta en el documento WO 2009/211761 y *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida se presenta en el documento EP365484.

45 En especial preferentemente, en una composición o mezcla que comprende un compuesto de fórmula (I) (en particular, uno de los compuestos específicos descritos en la presente, p. ej., cualquiera de los compuestos A1-A99, o el compuesto A100 o A101, o cualquiera de los compuestos A102-A108, o cualquiera de los compuestos A109-A211, o cualquiera de los compuestos P1-P30, presente como un compuesto libre y/o como una de sus sales agroquímicamente aceptables) y un protector, el protector comprende (p. ej., es) benoxacor, cloquintocet-mexilo, ácido cloquintocet o una de sus sales agroquímicamente aceptables, ciprosulfamida, mefenpir-dietilo, isoxadifeno-etilo y/o *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida. Incluso más preferentemente, el protector comprende (p. ej., es) cloquintocet-mexilo, ácido cloquintocet o una de sus sales agroquímicamente aceptables, mefenpir-dietilo y/o isoxadifeno-etilo; en particular para su uso en cereales que no sean avena tales como trigo, cebada, centeno y/o triticale. El cloquintocet-mexilo es particularmente valioso y es el protector más preferido, especialmente para su uso en cereales que no sean avena tales como trigo, cebada, centeno y/o triticale.

60 En las composiciones o mezclas mencionadas anteriormente que comprenden un compuesto de fórmula (I) (en particular, uno de los compuestos específicos descritos en la presente, p. ej., cualquiera de los compuestos A1-A99, o el compuesto A100 o A101, o cualquiera de los compuestos A102-A108, o cualquiera de los compuestos A109-

A211, o cualquiera de los compuestos P1-P30, presente en forma de compuesto libre y/o como una de sus sales agroquímicamente aceptables) con un protector, y la relación ponderal del compuesto de fórmula (I) respecto al protector puede variar dentro de un rango amplio y es, normalmente, de 200:1 a 1:200, especialmente de 50:1 a 1:50 o de 50:1 a 1:20, más especialmente de 20:1 a 1:20, incluso más especialmente de 20:1 a 1:10. Preferentemente, el protector comprende (p. ej., es) cloquintocet-mexilo, ácido cloquintocet o una de sus sales agroquímicamente aceptables, mepfenpir-dietilo y/o isoxadifeno-etilo, y la relación ponderal del compuesto de fórmula (I) respecto al protector es de 50:1 a 1:20, más preferentemente de 20:1 a 1:10, incluso más preferentemente de 15:1 a 1:2 (esto puede ser, por ejemplo, para su uso en cereales que no sean avena). Normalmente, estas relaciones ponderales se miden como el compuesto o los compuestos libres, es decir, excluyendo el peso de cualquier contraión o contraiones asociados que formen una sal.

Tasas de aplicación del herbicida (p. ej., compuesto de fórmula (I)) y/o protector: la tasa de aplicación del protector respecto al compuesto de fórmula (I) depende en gran medida del modo de aplicación. En el caso del tratamiento de campos y/o suelos y/o plantas (p. ej., en un campo o invernadero): se aplican, por ejemplo, de 0.5 a 1000 g de protector por ha, o preferentemente de 1 a 250 g o de 2 a 200 g de protector por ha; y/o generalmente de 1 a 2000 g del compuesto de fórmula (I) por ha, o se aplican preferentemente de 5 a 500 g o de 10 a 400 g del compuesto de fórmula (I) por ha. ha = hectárea. Normalmente, estas tasas de aplicación se miden como el compuesto libre, es decir, excluyendo el peso de cualquier contraión o contraiones asociados que formen una sal. En el tratamiento de campos, la aplicación del compuesto de fórmula (I) es preferentemente posemergencia.

Los compuestos y/o las composiciones herbicidas de acuerdo con la invención son adecuados para todos los métodos de aplicación habituales en agricultura, tales como, por ejemplo, aplicación preemergencia, aplicación posemergencia y preparación de la semilla. Se prefiere la aplicación posemergencia. Dependiendo del uso previsto, los protectores pueden utilizarse para pretratar el material seminal de la planta de cultivo (preparación de la semilla o plántulas) o se pueden introducir en el suelo antes o después de la siembra y a continuación aplicar el compuesto (sin protección) de fórmula (I), opcionalmente combinado con un coherbicida. Sin embargo, también se puede aplicar solo o junto con el herbicida antes o después de que emerjan las plantas. Por lo tanto, el tratamiento de las plantas o el material seminal con el protector puede llevarse a cabo, en principio, independientemente del momento en el que se aplique el herbicida. Generalmente se prefiere el tratamiento de la planta mediante la aplicación simultánea del herbicida y el protector (p. ej., en forma de una mezcla en tanque). La tasa de aplicación del protector respecto al herbicida depende en gran medida del modo de aplicación. En el caso del tratamiento de campos y/o suelos y/o plantas (p. ej., en un campo o invernadero), generalmente se aplican de 0.001 a 5.0 kg de protector/ha, preferentemente de 0.001 a 0.5 kg de protector/ha. ha = hectárea. En el caso de la preparación de semillas, generalmente se aplican de 0.001 a 10 g de protector/kg de semilla, preferentemente de 0.05 a 2 g de protector/kg de semilla. Cuando se aplica el protector en forma líquida, con impregnación de las semillas, poco antes de la siembra, es conveniente utilizar soluciones protectoras que contengan el principio activo en una concentración de 1 a 10 000 ppm, preferentemente de 100 a 1000 ppm.

En la invención, en el caso del tratamiento de campos y/o suelos y/o plantas (p. ej., aplicación posemergencia), generalmente se aplican de 1 a 2000 g de herbicida (en particular el compuesto de fórmula (I))/ha, pero preferentemente de 5 a 1000 g de herbicida (en particular el compuesto de fórmula (I))/ha, más preferentemente de 10 a 400 g de herbicida (en particular el compuesto de fórmula (I))/ha. Si se utiliza un protector, en el caso del tratamiento de campos y/o suelos y/o plantas (p. ej., aplicación posemergencia), generalmente se aplican de 0.5 a 1000 g de protector/ha, preferentemente de 2 a 500 g de protector/ha, más preferentemente de 5 a 200 g de protector/ha.

En una realización particular, la composición o mezcla que comprende el compuesto de fórmula (I) y uno o más herbicidas adicionales (p. ej., como los mencionados anteriormente en la presente) se puede aplicar junto con uno de los protectores mencionados en la presente, p. ej., anteriormente en la presente.

Los siguientes ejemplos ilustran la invención aún más pero sin limitarla.

EJEMPLOS DE PREPARACIONES

Los expertos en la técnica apreciarán que ciertos compuestos que se describen a continuación son β -cetoenoles, y como tales pueden existir como un único tautómero o como una mezcla de tautómeros cetoenólicos y dicetónicos, tal como se describe, por ejemplo, en J. March, *Advanced Organic Chemistry*, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos que se muestran a continuación y en las siguientes Tablas A1, A2, A3 o P1 se dibujan normalmente como un único tautómero enólico arbitrario, pero debería inferirse que esta descripción abarca la forma dicetónica y cualesquiera enoles posibles que pudieran originarse por tautomería. Cuando se observa más de un tautómero en la RMN de protón (^1H RMN), los datos que se muestran son para la mezcla de tautómeros. Asimismo, algunos de los compuestos que se muestran a continuación se dibujan como enantiómeros únicos con fines simplificados, pero a menos que se especifiquen como enantiómeros únicos, debería interpretarse que estas estructuras representan una mezcla de enantiómeros. Además, algunos de los compuestos pueden existir como diastereoisómeros y debería inferirse que estos pueden estar presentes como una mezcla de diastereoisómeros o como cualquier diastereoisómero único posible. En la sección experimental detallada, se elige el tautómero dicetónico a efectos de nomenclatura, incluso si el tautómero predominante está en forma enólica.

Abreviaturas empleadas en la presente:

DCM - diclorometano

DMF - *N,N*-dimetilformamida

DMSO - sulfóxido de dimetilo

5 EDTA - ácido etilendiaminotetraacético

Base de Hunig - *N,N*-diisopropiletilamina

LDA - diisopropilamida de litio

LiHMDS – hexametildisilazida de litio, denominada también 1,1,1,3,3,3-hexametildisilazan-2-ida de litio, o bis(trimetilsilil)amida de litio

10 P2tBu - 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentakis(dimetilamino)-2λ⁵,4λ⁵-catenadi(fosfaceno)

PTFE - politetrafluoroetileno

SPhos (S-Phos) - 2-(diciclohexilfosfino)-2',6'-dimetoxibifenilo

TFA – ácido trifluoroacético

THF - tetrahidrofurano

15 TA – temperatura ambiente (normalmente de aprox. 15-30 °C tal como aprox. 18-25 °C)

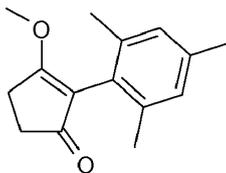
HPLC - cromatografía líquida de alta resolución (o alta presión)

MS – espectrometría de masas

RMN – resonancia magnética nuclear

20 con los datos de los espectros de ¹H RMN proporcionados en la presente: s = singlete, d = doblete, t = triplete, c = cuatriplete, dd = doblete de dobletes, m = multiplete, a = ancho

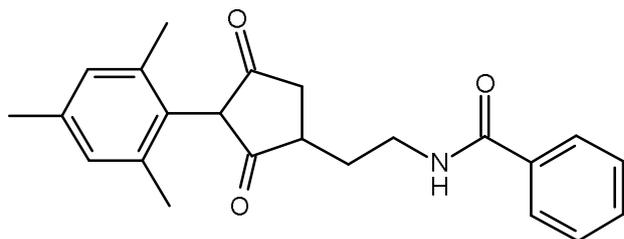
SFC - cromatografía de fluidos supercríticos

Intermedio 1 – Preparación de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (descrita previamente como Ejemplo 1 paso 1 en las páginas 54-55 del documento WO 2010/000773 A1)

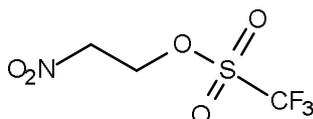
25 A una suspensión de 2-bromo-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona (6.75 g, 35.3 mmol), ácido 2,4,6-trimetilfenilborónico (6.99 g, 42.6 mmol) y fosfato de potasio recién molido (15 g, 70.6 mmol) en tolueno desgasificado (180 ml) en atmósfera de nitrógeno, se añaden Pd(OAc)₂ (159 mg, 0.71 mmol) y S-Phos (2-(diciclohexilfosfino)-2',6'-dimetoxibifenilo) (579 mg, 1.41 mmol), y la reacción se calienta hasta 90 °C con agitación en atmósfera de nitrógeno durante 4 horas. La mezcla de reacción se reparte entre acetato de etilo (150 mL) y agua (150 mL), se retira la fase orgánica, se añade gel de sílice a la fase orgánica, se evapora el disolvente a presión reducida y se purifica el residuo mediante cromatografía flash en gel de sílice para obtener 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (6.2 g).

30

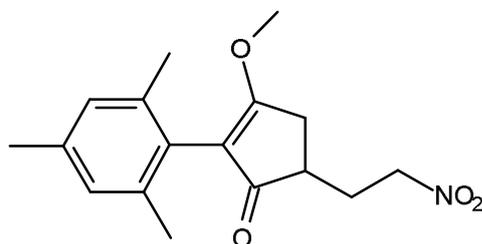
Ejemplo 1 – Síntesis del compuesto A1



(A1)

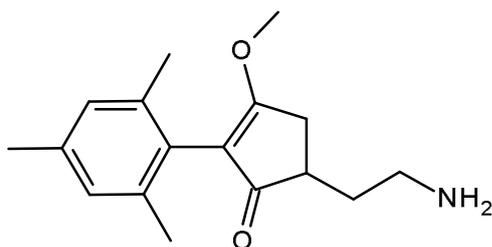
Paso uno: Síntesis de trifluorometanosulfonato de 2-nitroetilo

5 A una solución agitada de 2-nitroetanol (4.88 mL, 68 mmol) en diclorometano (200 mL) a 0 °C se añadió piridina (11 mL, 136 mmol) seguida de la adición gota a gota de anhídrido trifluorometanosulfónico. El color de la reacción se transformó de rosa pálido a amarillo pasando por rojo oscuro durante la adición del anhídrido. La reacción se dejó calentar hasta temperatura ambiente durante tres horas y después se detuvo mediante la adición cuidadosa de H₂O (200 mL). Se separaron las fases y se extrajo la fase acuosa con más diclorometano (2 x 100 mL). Los extractos orgánicos se lavaron con solución acuosa saturada de NH₄Cl (100 mL) y H₂O (100 mL), se secaron con MgSO₄, se filtraron y se evaporaron a sequedad a presión reducida para obtener el producto deseado (4.2 g, 28%) como un aceite amarillo/marrón que se utilizó en los pasos siguientes sin purificación adicional. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ_H 5.00 (t, 2H), 4.75 (t, 2H). ¹⁹F RMN (375 MHz, CDCl₃) δ_F -74.1

Paso dos: Síntesis de 3-metoxi-5-(2-nitroetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona

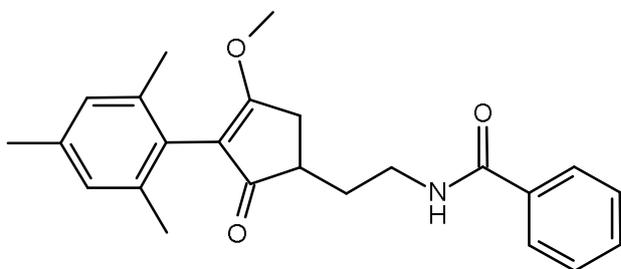
15 A una solución agitada de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (2.30 g, 10.0 mmol) (p. ej., que se puede preparar mediante el método mostrado en el Intermedio 1 de la presente o que se puede preparar mediante uno o varios métodos descritos en el documento WO 2010/069864 A1 y/o WO 2011/073060 A2) en tetrahidrofurano (100 mL) a -78 °C en atmósfera de N₂ se añadió gota a gota diisopropilamida de litio (6.11 mL de una solución 1.8 M en tetrahidrofurano/etilbenceno/heptano, 11.0 mmol). La reacción se agitó a -78 °C durante 105 minutos y a continuación se añadió gota a gota una solución de trifluorometanosulfonato de 2-nitroetilo (2.68 g, 12.0 mmol) en tetrahidrofurano (10 mL). La reacción se agitó a -78 °C durante 30 minutos y después se dejó calentar hasta temperatura ambiente. La reacción se detuvo cuidadosamente con H₂O (200 mL) y se extrajo con EtOAc (3 x 100 mL). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera (50 mL), se secaron con MgSO₄, se filtraron y se evaporaron a sequedad a presión reducida para obtener un aceite marrón. El producto crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de un 100% de hexano a un 100% de EtOAc para obtener el compuesto deseado (780 mg, 26%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 6.85 (s, 2H), 4.65 (t, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.05 (dd, 1H), 2.75-2.65 (m, 1H) 2.55-2.40 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.30 (m, 1H), 2.05 (s, 6H).

Paso tres: Síntesis de 5-(2-aminoetil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona



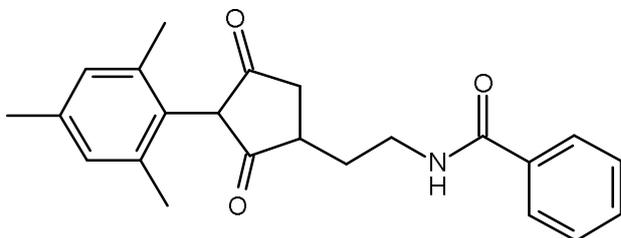
5 A una solución agitada de 3-metoxi-5-(2-nitroetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (108 mg, 0.356 mmol) en MeOH (10 mL) en atmósfera de N₂ se añadió formiato de amonio (67 mg, 1.07 mmol) seguido de Pd/C al 10% (5 mg, catalítico). La reacción se calentó a reflujo durante 1 hora, se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se filtró a través de un lecho de Celite, lavando con más MeOH (10 mL). Se eliminó el disolvente a presión reducida para obtener el producto crudo (64 mg) que se utilizó sin purificación adicional. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 6.85 (s, 2H), 3.70 (s, 3H), 2.95 (dd, 1H), 2.90-2.75 (m, 2H), 2.75-2.65 (m, 1H), 2.50 (d, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.10-2.05 (m, 1H), 2.05 (2 x s, 2 x 3H), 1.65-1.55 (m, 1H).

Paso cuatro: Síntesis de N-[2-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-3-en-1-il]etil]benzamida



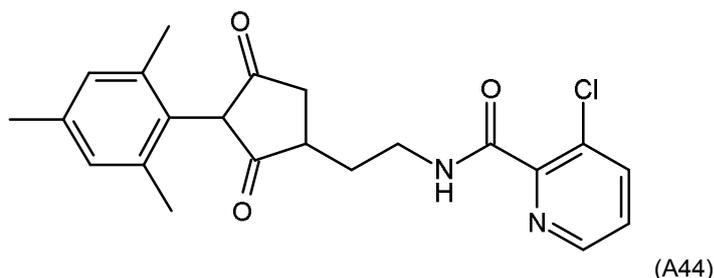
10 A una solución agitada de la 5-(2-aminoetil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona cruda (64 mg, 0.234 mmol) en diclorometano (5 mL) se añadió Et₃N (65 uL, 0.468 mmol) seguido de cloruro de benzoilo (29 uL, 0.25 mmol). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 72 horas y a continuación se detuvo con H₂O (15 mL) y se extrajo con EtOAc (3 x 10 mL). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera (10 mL), se secaron con MgSO₄, se filtraron y se evaporaron a sequedad a presión reducida para obtener un aceite marrón. El producto crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de un 100% de hexano a un 100% de EtOAc para obtener el producto deseado (61 mg, 69%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 7.80 (d, 2H), 7.50-7.35 (m, 4H), 6.85 (2 x s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.70-3.60 (m, 2H), 3.10 (dd, 1H), 2.80-2.75 (m, 1H), 2.55 (d, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.05 (2 x s, 6H), 2.05-1.90 (2H, m).

20 **Paso cinco: Síntesis de N-[2-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentil]etil]benzamida**

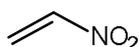


25 Una solución de N-[2-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-3-en-1-il]etil]benzamida (48 mg, 0.127 mmol) en acetona (1 mL) y HCl 2 M (1 mL) se calentó a 80 °C durante 50 minutos con irradiación de microondas. La reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con H₂O y se extrajo con EtOAc (3 x 10 mL). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera (10 mL), se secaron con MgSO₄, se filtraron y se evaporaron a sequedad a presión reducida para obtener un aceite de color marrón pálido. El producto crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de un 100% de hexano a un 100% de EtOAc para obtener el producto deseado (25 mg, 54%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, d₆-acetona) δ 8.30 (a, 1H), 7.97-7.93 (m, 2H), 7.60-7.55 (m, 1H), 7.50-7.45 (m, 2H), 6.85 (s, 2H), 3.80-3.70 (a, 1H), 3.60-3.50 (m, 1H), 3.00-2.70 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.15-2.05 (m, 1H), 2.05 (2 x s, 2 x 3H), 1.95-1.90 (m, 1H)

Ejemplo 2 – Síntesis del compuesto A44

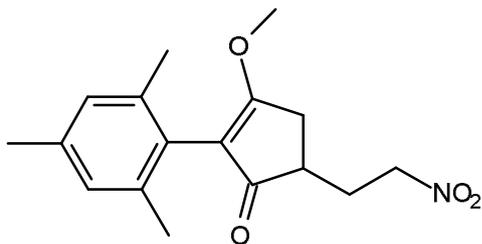


Paso uno: Síntesis de 1-nitroetileno



5 En un matraz equipado con un equipo de destilación se introdujeron nitroetanol (60.0 g, 0.44 mol) y anhídrido ftálico (146.38 g, 0.66 mol). Se creó en el matraz un vacío de 110 mmbar, y el matraz recolector se enfrió con hielo seco y acetona. La mezcla se calentó a continuación hasta 130 °C. Después de 1 h a 130 °C, la temperatura se incrementó lentamente hasta 180 °C en 2 h. Una vez finalizada la destilación, se dejó de calentar y el destilado se disolvió en 100 mL de tetrahidrofurano anhidro, se secó con CaCl₂ anhidro y se conservó como una solución en tetrahidrofurano (33.34 g, 69%). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 6.85-6.95 (a, 1H), 6.25-6.35 (a, 1H), 5.60-5.70 (s a, 1H).

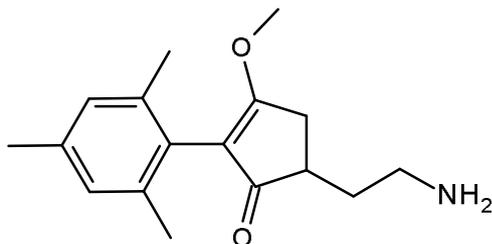
10 **Paso dos: Síntesis de 3-metoxi-5-(2-nitroetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona**



15 A una solución de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (2.50 g, 10.86 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (25 mL) a -78 °C en atmósfera de argón se añadió gota a gota diisopropilamida de litio (1.8 M en tetrahidrofurano, 6.03 mL, 10.86 mmol) manteniendo la temperatura por debajo de -50 °C. Una vez finalizada la adición, la mezcla se dejó agitar durante 30 min. A continuación, se añadió una solución del nitroetileno (2.38 mL, 10.86 mmol) gota a gota durante 1 h utilizando un embudo de adición. Una vez finalizada la adición, la mezcla se agitó 30 min antes de dejarla calentar hasta temperatura ambiente. Tras agitar 1 h, la reacción se detuvo mediante la adición de agua (50 mL) seguida de una solución saturada de cloruro de amonio (50 mL). Posteriormente, la mezcla se extrajo con acetato de etilo (3x20 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron, se filtraron y se evaporaron a sequedad. El producto crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de hexano/acetato de etilo para obtener el producto deseado (2.00 g, 60%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 6.85 (s, 2H), 4.65 (t, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.05 (dd, 1H), 2.75-2.65 (m, 1H) 2.55-2.40 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.30 (m, 1H), 2.05 (s, 6H).

20

Paso tres: Síntesis de 5-(2-aminoetil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona

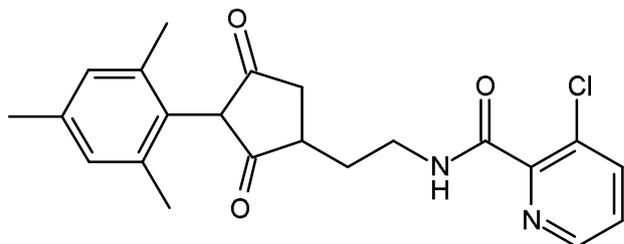


25 A una solución de 3-metoxi-5-(2-nitroetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (2.00 g, 6.59 mmol) en MeOH (40.0 mL) se añadió formiato de amonio (2.08 g, 32.96 mmol) seguido de paladio sobre carbón (al 10%, 0.50 g). Posteriormente, la mezcla se agitó durante dos horas a temperatura ambiente y, a continuación, se filtró a través de un lecho de Celite y el filtrado se evaporó a sequedad a presión reducida. El residuo se disolvió posteriormente en

diclorometano (20 mL) y se lavó con solución saturada de bicarbonato sódico (2x10 mL). La fase orgánica se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se evaporó a sequedad a presión reducida para obtener el producto crudo (0.35 g, 19%) como un aceite marrón que se utilizó sin purificación adicional. ¹H RMN (400 MHz, d₄-metanol) 6.86-6.89 (s, 2H), 4.64-4.70 (t, 2H), 3.71-3.73 (s, 3H), 3.00-3.08 (m, 1H), 2.66-2.75 (m, 1H), 2.39-2.52 (m, 2H), 2.24-2.32 (m, 4H), 2.06-2.09 (d, 6H).

5

Paso cuatro: Síntesis de 3-cloro-N-[2-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentil]etil]piridin-2-carboxamida



A una solución agitada de la 5-(2-aminoetil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (0.250 g, 0.91 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (9 mL) se añadieron la base de Hunig (*N,N*-diisopropiletilamina) (0.40 mL, 2.29 mmol) y el ácido 3-cloropicolínico (0.16 g, 1.01 mmol). A continuación, la reacción se enfrió hasta 0 °C y se añadió hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxi(tripirrolidin-1-il)fosfonio (0.97 g, 1.83 mmol). Una vez finalizada la adición, la reacción calentó hasta temperatura ambiente y se agitó durante dos horas. A continuación, la reacción se evaporó a sequedad a presión reducida y el producto crudo se empleó en el siguiente paso sin purificación adicional.

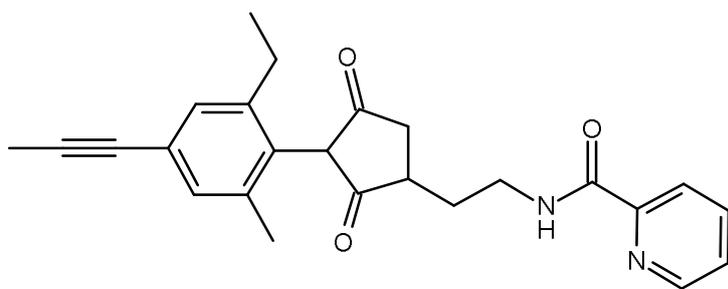
10

A una solución del éter enólico crudo en EtOH (4 mL) se añadió ácido clorhídrico 2 M (4 mL) y posteriormente la mezcla se calentó hasta 60 °C durante 4 horas. A continuación, la reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se evaporó a sequedad a presión reducida. El producto crudo se purificó seguidamente en un sistema de purificación dirigida por masas FractionLynx para obtener el producto deseado (0.072 g, 18%) como un sólido blanquecino. ¹H RMN (400 MHz, d₄-metanol) δ, 8.50-8.54 (m, 1H), 7.94-7.98 (m, 1H), 7.47-7.52 (m, 1H), 6.84-6.88 (s, 2H) 3.49-3.64 (m, 2H), 2.91-2.99 (m, 1H), 2.81-2.90 (m, 1H), 2.47-2.55 (m, 1H), 2.16-2.27 (m, 4H), 2.03-2.07 (s, 6H), 1.67-1.78 (1H, m).

15

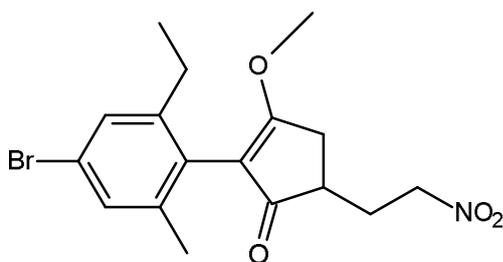
20

Ejemplo 3 – Síntesis del compuesto A84



(A84)

Paso uno: Síntesis de 2-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-3-metoxi-5-(2-nitroetil)ciclopent-2-en-1-ona

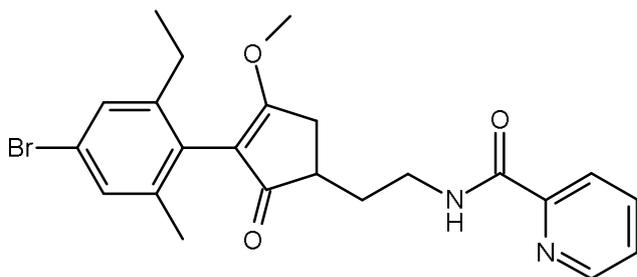


25

A una solución de 2-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona (8.0 g, 25.87 mmol) en tetrahidrofurano (130 mL), en atmósfera de nitrógeno a una temperatura comprendida entre -50 °C y -60 °C se añadió gota a gota una solución de diisopropilamida de litio (1.8 M en tetrahidrofurano/éter/benceno) (25.87 mmol, 14.4 mL) manteniendo la temperatura constante. A continuación, la mezcla se agitó durante 30 min a una temperatura comprendida entre -50 °C y -60 °C. Posteriormente, se añadió una solución de 1-nitroetileno (0.98

equiv., 25.36 mmol, 14.94 mL, 1.852 g) en tetrahidrofurano muy lentamente, de nuevo manteniendo la temperatura constante. La mezcla de reacción se agitó durante 30 min antes de dejarla calentar hasta temperatura ambiente. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 h antes de detenerla mediante la adición de cloruro de amonio saturado (100 mL). La mezcla se extrajo a continuación con diclorometano (3 x 100 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron con MgSO₄, se filtraron y se evaporaron a sequedad a presión reducida. El producto crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (5.64 g, 57%) como un aceite marrón. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 7.22 (s, 2H), 4.67 (t, 2H), 3.75 (s, 3H), 3.10-3.03 (m, 1H), 2.75-2.65 (m, 1H), 2.50-2.15 (m, 5H), 2.09 (s, 3H), 1.15-1.08 (m, 3H).

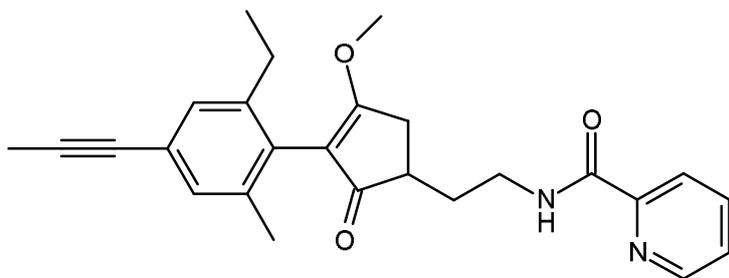
Paso dos: Síntesis de *N*-[2-[3-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



A una suspensión de 2-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-3-metoxi-5-(2-nitroetil)ciclopent-2-en-1-ona (5.269 g, 13.79 mmol) en EtOH (70 mL) en atmósfera de nitrógeno se añadió HBr conc. (10.54 mL, 194 mmol). Se añadió Zn en polvo (1.80 g, 27.57 mmol), y el sustrato inmediatamente se disolvió y se observó una reacción exotérmica. La temperatura de la reacción se volvió a reducir hasta temperatura ambiente mediante enfriamiento con un baño de hielo y se agitó la reacción a temperatura ambiente durante 4 h. A continuación, la reacción se enfrió hasta 0 °C y se añadió otra porción de Zn en polvo (1.80 gramos, 27.57 mmol) en porciones. La reacción se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 2 horas más. La reacción se vertió en agua (100 mL) y el pH se ajustó cuidadosamente hasta ~7 mediante la adición de solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio. El polvo blanco resultante se filtró, se lavó con hidrogenocarbonato de sodio acuoso saturado, hexano y una pequeña cantidad de éter, y se secó a presión reducida para obtener la amina cruda como un sólido blanco (9.8 g).

A la amina cruda (8.84 g) en diclorometano (90 mL) a 10 °C se añadió base de Hunig (5.14 mL, 30.1 mmol) seguida de una adición en porciones de clorhidrato de cloruro de piridin-2-carbonilo (5.36 g, 30.1 mmol), manteniendo la temperatura por debajo de 10 °C. A continuación, la reacción se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas más. La reacción se detuvo añadiendo cloruro de amonio acuoso saturado (200 mL) y la mezcla se extrajo con diclorometano (2x 200 mL). Los extractos orgánicos combinados se hicieron pasar a través de un filtro sinterizado de PTFE y se purificaron mediante cromatografía flash en sílice para obtener el compuesto deseado (1.27 g, 11%) como un sólido blanquecino pegajoso. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 1.08 (td, 3H), 1.73 - 1.84 (m, 1H), 2.06 (s, 1.5H), 2.08 (s, 1.5H), 2.19 - 2.31 (m, 1H), 2.32 - 2.47 (m, 2H), 2.63 (dd, 1H), 2.70 - 2.79 (m, 1H), 3.10 (ddd, 1H), 3.55 - 3.66 (m, 1H), 3.69 - 3.76 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 7.18 - 7.25 (m, 2H), 7.44 (ddd, 1H), 7.86 (td, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.27 (s a, 1H), 8.56 (d, 1H).

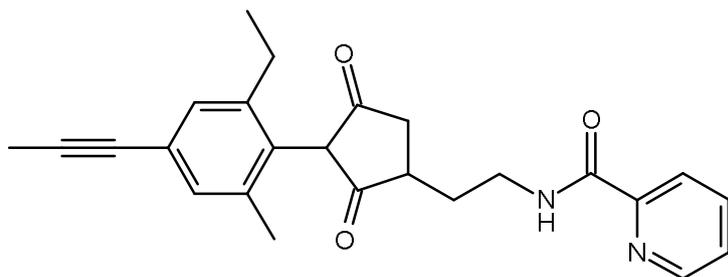
Paso tres: Síntesis de *N*-[2-[3-(2-etil-6-metil-4-prop-1-inilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



A un matraz que contenía *N*-[2-[3-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (320 mg, 0.6996 mmol), el aducto de dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) y diclorometano (78.4 mg, 0.105 mmol), yoduro de cobre (I) (27 mg, 0.14 mmol) y fluoruro de cesio (0.2147 g, 1.4 mmol) en atmósfera de nitrógeno se añadió *N,N*-dimetilformamida anhidra desgasificada (3.2 mL), seguida de tributil(1-propinil)estaño (0.2666 g, 0.77 mmol) y la reacción se calentó hasta 100 °C durante 3 horas. La mezcla se dejó

enfriar hasta temperatura ambiente, se diluyó con EtOAc (50 mL) y se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (50 mL). La capa orgánica se separó, se lavó con salmuera saturada (2 x 50 mL), y la capa orgánica se hizo pasar a través de un filtro sinterizado de PTFE, se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el compuesto deseado (0.184 g, 63%) como una mezcla de atropisómeros. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.56 (d, 1H), 8.27 (a, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.90-7.80 (m, 1H), 7.47- 7.40 (m, 1H), 7.15-7.07 (m, 2H), 3.78-3.69 (m, 4H) 3.10-3.06 (m, 1 H), 3.66-3.55 (m, 1H), 2.77-2.69 (m, 1H), 2.61 (dd, 1H) 2.4 -2.32 (m, 2H), 2.31-2.21 (m, 1H), 2.07 (s, 1.5H), 2.05 (s, 1.5H), 2.03 (s, 3H), 1.85-1.73 (m, 1H), 1.10-1.06 (m, 3H).

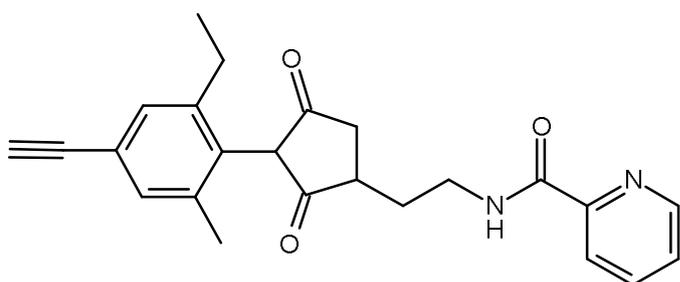
10 **Paso cuatro: Síntesis de *N*-[2-[3-(2-etil-6-metil-4-prop-1-inilfenil)-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida**



A una solución agitada de *N*-[2-[3-(2-etil-6-metil-4-prop-1-inilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (184 mg, 0.4418 mmol) en acetona (1 mL) se añadió HCl 2 M (1 mL) y la reacción se calentó hasta 50 °C durante 5 horas.

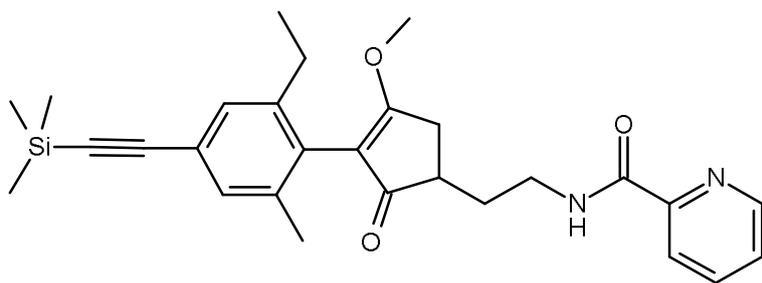
15 La reacción se concentró a presión reducida para eliminar la acetona en exceso, se diluyó con EtOAc (25 mL) y se extrajo con una solución de K₂CO₃ 1 M (25 mL). La capa orgánica se reservó y a continuación la capa acuosa se acidificó hasta pH6 con HCl concentrado (se observó un precipitado) y se extrajo con EtOAc (25 mL). Esta capa orgánica proporcionó una recuperación baja, de modo que la capa de EtOAc inicial se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL) y se combinó con el otro extracto orgánico de lavado. Esta combinación se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash utilizando un gradiente de un 2-10% de MeOH en diclorometano para obtener el compuesto deseado (105 mg, 59%) como una goma marrón correspondiente a una mezcla de atropisómeros. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 1.12 (dt, 3H), 1.78 - 1.94 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.11 (s, 1.5H), 2.15 (s, 1.5H), 2.18 (d, 1H), 2.44 (dt, 2H), 2.81 - 3.04 (m, 2H), 3.35 - 3.53 (m, 1H), 4.04 - 4.25 (m, 1H), 7.05 - 7.19 (m, 2H), 7.46 - 7.60 (m, 1H), 7.91 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.69 (br. s., 1H), 12.25 (s a, 1H).

25 **Ejemplo 4 – Síntesis del compuesto A85**



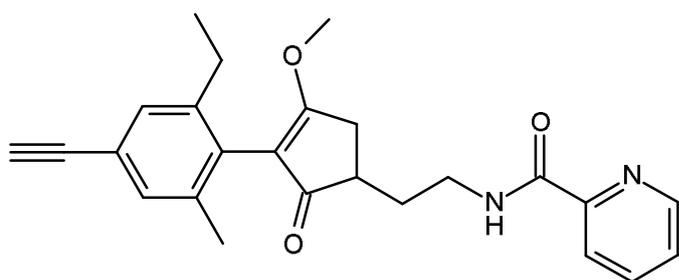
(A85)

Paso uno: Síntesis de *N*-[2-[3-[2-etil-6-metil-4-(2-trimetilsililetinil)fenil]-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



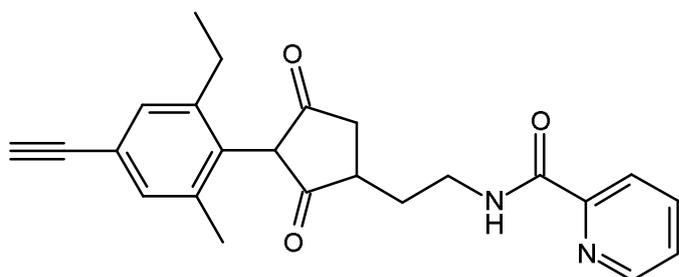
5 A un matraz que contenía *N*-[2-[3-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (314 mg, 0.69 mmol) y paladio-tetrakis(trifenilfosfina) (0.034 mmol, 0.04 g) en atmósfera de nitrógeno se añadió tolueno anhidro desgasificado (10 mL), seguido de trimetil(2-tributylestannil)etilo (0.83 mmol, 0.32 g) y la reacción se calentó hasta 100 °C durante 17 horas. La reacción se filtró a través de un filtro sinterizado, se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash utilizando un gradiente de un 30-100% de EtOAc en hexano para obtener el compuesto deseado (283 mg, 97%) como una goma de color amarillo pálido correspondiente a una mezcla de atropisómeros. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 8.56 (d, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.86 (td, 1H), 7.41 - 7.46 (m, 1H), 7.15 - 7.22 (m, 2H), 3.73 - 3.80 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.56 - 3.65 (m, 1H), 3.07 (ddd, 1H), 2.69 - 2.78 (m, 1H), 2.61 (dd, 1H), 2.33 - 2.45 (m, 2H), 2.25 (dd, 1H), 2.07 (s, 1.5H), 2.05 (s, 1.5H), 1.75 - 1.84 (m, 1H), 1.08 (td, 3H), 0.21 - 0.26 (m, 9H).

Paso dos: Síntesis de *N*-[2-[3-(2-etil-4-etinil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



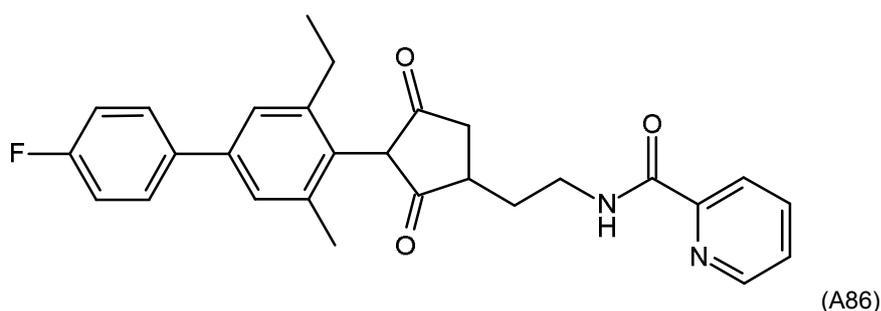
15 A una solución de *N*-[2-[3-(2-etil-6-metil-4-(2-trimetilsililetinil)fenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (283 mg, 0.5962 mmol) en tetrahidrofurano (10 mL) a 0 °C se añadió gota a gota fluoruro de tetrabutilamonio (1.0 mol/L) en tetrahidrofurano (3 equiv., 1.8 mL, 1.789 mmol, 1.0 mol/L) durante un periodo de 2 minutos. A continuación, la reacción se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 90 minutos más. La reacción se detuvo mediante la adición de cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL) y se extrajo con acetato de etilo (25 mL). A continuación, la capa orgánica se filtró a través de un filtro sinterizado de PTFE, se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de un 50-100% de EtOAc en hexano para obtener el producto deseado como una mezcla de atropisómeros (207 mg, 86%) en forma de una goma sin necesidad de una purificación adicional. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 8.56 (d, 1H), 8.27 (a, 1H), 8.19 (d, 1H) 7.86 (td, 1H) 7.17-7.25 (m, 2H), 7.41-7.47 (m, 1H), 3.76 (s, 3H) 3.69-3.74 (m, 1H), 3.55-3.65 (m, 1H), 3.10 (ddd, 1H), 3.02 (s, 1H), 2.74 (ddd, 1H), 2.63 (dd, 1H), 2.34-2.45 (m, 2H), 2.20-2.32 (m, 1H) 2.09 (s, 1.5H), 2.07 (s, 1.5H), 1.73 -1.85, (m, 1H), 1.09 (td, 3H).

Paso tres: Síntesis de *N*-[2-[3-(2-etil-4-etinil-6-metilfenil)-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida

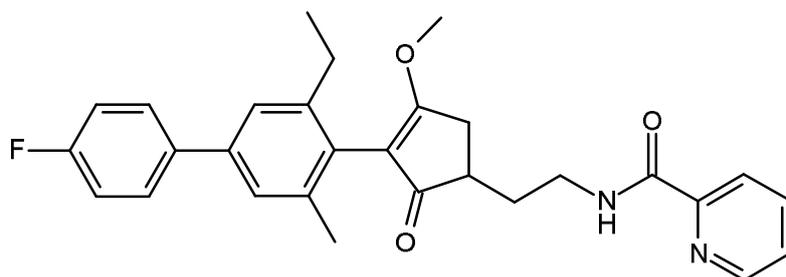


5 A una solución de *N*-[2-[3-(2-etil-4-etinil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (207 mg, 0.5143 mmol) en acetona (1 mL) se añadió HCl 2 N (1 mL) y la reacción se calentó hasta 50 °C durante 5 horas. La reacción se concentró al vacío para eliminar la acetona en exceso, se diluyó con HCl 2 N (25 mL) y se extrajo con EtOAc (25 mL) (la capa orgánica se reservó). El pH de la capa acuosa se ajustó a continuación a pH6 con K₂CO₃ 2 N y se extrajo con EtOAc (25 mL). La capa de EtOAc inicial se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL) y se combinó con el otro extracto orgánico de lavado. Esta combinación se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash utilizando un gradiente de un 2-10% de MeOH en diclorometano para obtener el producto deseado (167 mg, 84%) como un sólido pegajoso. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 1.05 - 1.18 (m, 3H), 1.87 (t, 1H), 2.10 - 2.23 (m, 4H), 2.40 - 2.56 (m, 2H), 2.83 - 3.00 (m, 2H), 3.01 (s, 1H), 3.43 (d, 1H), 4.08 - 4.21 (m, 1H), 7.20 - 7.26 (m, 2H), 7.42 - 7.50 (m, 1H), 7.92 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.71 (s a, 1H).

Ejemplo 5 – Síntesis del compuesto A86

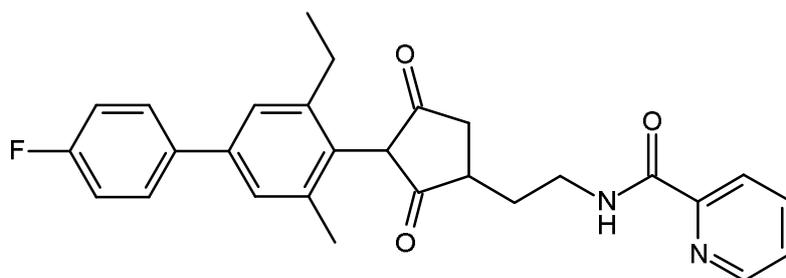


Paso uno: Síntesis de *N*-[2-[3-[2-etil-4-(4-fluorofenil)-6-metilfenil]-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



15 A una solución de *N*-[2-[3-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (200 mg, 0.4373 mmol) en 1,4-dioxano (2 mL) se añadieron fluoruro de cesio (3 equiv., 1.312 mmol, 0.1993 g), ácido (4-fluorofenil)borónico (1.5 equiv., 0.6559 mmol, 0.09177 g) y bis(difenilfosfino)ferrocenodicloropaladio (II) (0.2 equiv., 0.08745 mmol, 0.06399 g). A continuación, la reacción se calentó con irradiación de microondas a 120 °C durante 45 min. La reacción se diluyó con acetato de etilo (20 mL) y se filtró a través de Celite. Seguidamente, el filtrado orgánico se redujo al vacío antes de purificarlo mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (183 mg, 89%) como una goma marrón.

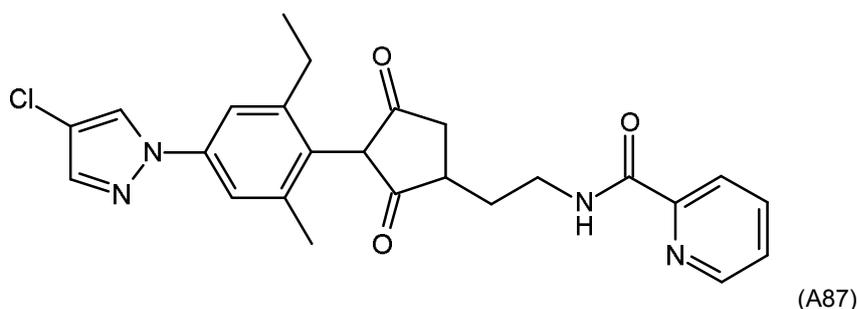
Paso dos: Síntesis de *N*-[2-[3-[2-etil-4-(4-fluorofenil)-6-metilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida



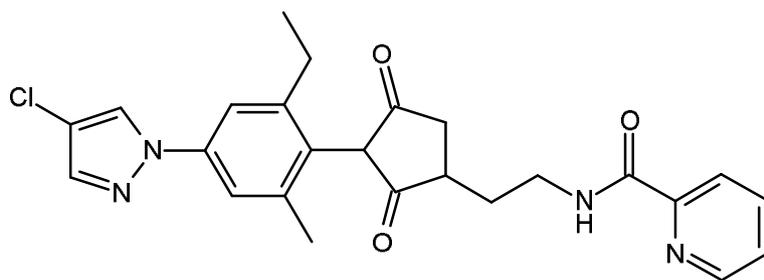
25 A una solución de *N*-[2-[3-[2-etil-4-(4-fluorofenil)-6-metilfenil]-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (187 mg, 0.3957 mmol) en acetona (1 mL) se añadió HCl 2 N (1 mL) y la reacción se calentó hasta 50 °C durante 5 horas. La reacción se concentró al vacío para eliminar la acetona en exceso, se ajustó el pH de la capa

acuosa a aproximadamente 7 con K_2CO_3 2 N seguido de cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL) y se extrajo con EtOAc (25 mL). La capa orgánica se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de un 50-100% de EtOAc en hexano para obtener el producto deseado (169 mg, 93% de rendimiento) como una mezcla de atropisómeros. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.35 (a, 1H), 8.71 (a, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.96-7.88 (m, 1H), 7.57-7.49 (m, 3H), 7.26 (s, 2H), 7.10 (t, 2H), 4.18 (d, 1H), 3.44 (d, 1H), 3.04-2.96 (m, 1H), 2.96-2.88 (m, 1H), 2.58-2.54 (m, 2H), 2.26 (s, 1.5H), 2.22 (s, 1.5H), 2.26-2.17 (m, 2H), 1.89 (t, 1H), 1.20-1.16 (m, 3H).

Ejemplo 6 – Síntesis del compuesto A87

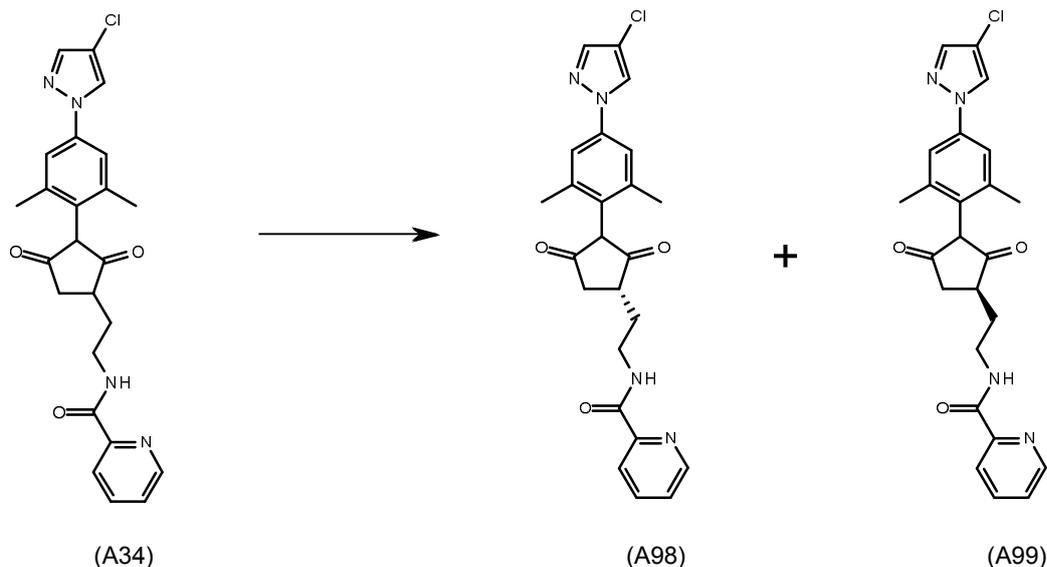


10 **Paso uno: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2-etil-6-metilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida**



15 A un matraz de 3 bocas que contenía *N*-[2-[3-(4-bromo-2-etil-6-metilfenil)-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (340 mg, 0.7433 mmol) se añadieron 4-cloropirazol (2 equiv., 1.487 mmol, 0.1524 g), yoduro de cobre (2 equiv., 1.487 mmol, 0.2831 g), dimetilglicina (4 equiv., 2.973 mmol, 0.3066 g) y carbonato de potasio (4 equiv., 2.973 mmol, 0.4151 g), y el recipiente se purgó con nitrógeno. A continuación, se añadió sulfóxido de dimetilo (anhidro) (6.8 mL) y la reacción se calentó hasta 140 °C durante 90 min. La reacción se filtró a través de un filtro sinterizado de PTFE, se diluyó con EtOAc (50 mL) y se extrajo con K_2CO_3 2 N (25 mL). La capa orgánica se neutralizó con cloruro de amonio acuoso saturado (50 mL), se extrajo con EtOAc (50 mL) y se lavó con salmuera (3 x 50 mL). A continuación, la capa orgánica se filtró a través de un filtro sinterizado de PTFE, se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (63 mg, 18%) como una goma marrón. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.71 (s a, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.84 - 8.01, (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.49 - 7.57 (m, 1H), 7.32 - 7.40 (m, 2H), 4.11 - 4.25 (m, 1H), 3.46 (s a, 1H), 2.83 - 3.05 (m, 2H), 2.54 (dt, 2H), 2.23 (d, 5H), 1.88 (s a, 1H), 1.11 - 1.23 (m, 3H).

25 **Ejemplo 7 - Separación por HPLC quiral de los enantiómeros del compuesto A34 (compuestos A98-A99)**



El compuesto A34 (racémico) se separó en los compuestos enantiómeros A98 y A99 utilizando una columna de HPLC quiral, mediante el siguiente método y en las siguientes condiciones.

- 5 La columna de HPLC quiral empleada era una columna de HPLC (s,s) WhelkO1 de 5 micrones y 21 mm x 250 mm, fabricada por Regis Technologies, Inc. En esta columna, la fase estacionaria quiral es (S,S) 1-(3-5-dinitrobenzamido)-1,2,3,4-tetrahidrofenantreno.

El sistema de disolventes empleado como eluyente para la columna fue una mezcla 30:70 (en volumen) del Disolvente A y el Disolvente B, en la que:

- 10 el Disolvente A es isohexano que contiene un 0.1% v/v de ácido trifluoroacético (TFA) y el Disolvente B es etanol.

Otras condiciones eran las siguientes:

Flujo a través de la columna:	21 mL/minuto.
Tiempo de análisis:	20 minutos.

Carga (compuesto colocado sobre la columna): 50 mg/mL del compuesto en etanol.

- 15 Volumen de muestra (compuesto) inyectado por análisis = 1800 microlitros.

Número de inyecciones del compuesto = 5.

Cantidad del compuesto racémico A34 empleada: 350 mg.

- 20 La HPLC quiral de un total de 350 mg del compuesto A34 en las condiciones anteriores proporcionó 131 mg del compuesto A98 (con un 100% de exceso enantiomérico (e.e.) y un tiempo de retención de 12.04 minutos en las condiciones anteriores) y 135 mg del compuesto A99 (con un 99.1% de exceso enantiomérico (e.e.) y un tiempo de retención de 14.26 minutos en las condiciones anteriores).

Abreviatura: HPLC = cromatografía líquida de alta resolución (o alta presión).

Realización alternativa: Separación por HPLC quiral del compuesto A87 en los compuestos enantioméricos A100 y A101

- 25 Utilizando condiciones generalmente similares (p. ej., véanse las anteriores y las que se indican más adelante), el compuesto A87 se separó en los compuestos enantioméricos A100 y A101.

Nota general sobre la separación por HPLC quiral de enantiómeros:

- 30 El procedimiento anterior en el que se utiliza HPLC quiral se puede emplear para separar los enantiómeros de otros compuestos de fórmula (I) de la presente invención. Las columnas quirales que pueden ser útiles para conseguir esto son las siguientes:

columna de HPLC (s,s) WhelkO1 de 5 micrones y 21 mm x 250 mm, fabricada por Regis Technologies, Inc. [en esta columna, la fase estacionaria quiral es (S,S) 1-(3-5-dinitrobenzamido)-1,2,3,4-tetrahidrofenantreno];

Kromasil® AmyCoat™ [cuya fase estacionaria quiral es tris-(3,5-dimetilfenil)carbamoilamilosa];

Kromasil® CelluCoat™ [cuya fase estacionaria quiral es tris-(3,5-dimetilfenil)carbamoilcelulosa];

5 Chiralpak® IA [cuya fase estacionaria quiral es un derivado de tipo (3,5-dimetilfenil)carbamato de amilosa];

Chiralpak® IB [cuya fase estacionaria quiral es un derivado de tipo tris-(3,5-dimetilfenil)carbamato de celulosa];

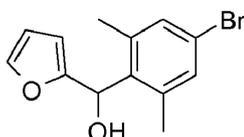
Chiralpak® IC [cuya fase estacionaria quiral es tris-(3,5-diclorofenil)carbamato de celulosa];

Lux® Amilosa-2 [cuya fase estacionaria quiral es tris-(5-cloro-2-metilfenil)carbamato de amilosa]; o

Lux® Celulosa-2 [cuya fase estacionaria quiral es tris(3-cloro-4-metilfenil)carbamato de celulosa].

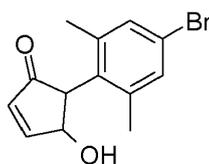
10 Intermedio 2: Preparación de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona

Paso 1: Preparación de ([4-bromo-2,6-dimetilfenil]furan-2-il)metanol (descrito previamente en el Ejemplo 1 paso 1 en las páginas 51-52 del documento WO 2010/089210 A1)



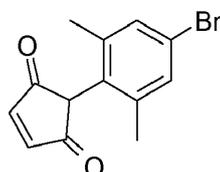
15 Se disuelve 4-bromo-2,6-dimetil-1-yodobenceno (5 g, 16 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (20 mL) y se enfría hasta -78 °C en atmósfera de nitrógeno anhidro. Se añade cloruro de isopropilmagnesio (solución 2 M en tetrahidrofurano, 10 mL, 20 mmol) gota a gota con agitación enérgica durante 30 minutos. Cuando se completa la adición, se permite que la reacción se caliente hasta temperatura ambiente y se agita durante 30 minutos a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se enfría hasta -78 °C y se añade gota a gota una solución de 2-furaldehído (2.4 g, 25 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (10 mL) durante 30 minutos. Una vez que se completa la adición, se permite que la reacción se caliente hasta temperatura ambiente y se sigue agitando durante 2 horas. Se añade una solución de cloruro de amonio acuoso saturado (30 mL) y la mezcla se extrae con diclorometano (3 x 25 mL). Los extractos orgánicos se combinan, se lavan con salmuera, se secan con sulfato de magnesio anhidro, se filtran y se evapora el filtrado a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener ([4-bromo-2,6-dimetilfenil]furan-2-il)metanol (3.71 g).

25 Paso 2: Preparación de 5-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (descrita previamente en el Ejemplo 1 paso 2 en la página 52 del documento WO 2010/089210 A1)



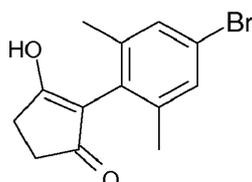
30 Se añade ácido polifosfórico (500 mg) a una solución caliente (55 °C) de ([4-bromo-2,6-dimetilfenil]furan-2-il)metanol (843 mg, 3 mmol) en acetona (8 mL) y agua (2 mL) y la mezcla se calienta a 55 °C durante 24 horas. La mezcla se enfría hasta temperatura ambiente y se elimina la acetona a presión reducida. La mezcla remanente se reparte entre éter dietílico (20 mL) y agua (20 mL). La fase acuosa se extrae con éter (2 x 50 mL) y a continuación las fases orgánicas se combinan, se lavan con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio (20 mL) y salmuera (20 mL), se secan con sulfato de magnesio anhidro, se filtran y se evapora el filtrado a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 5-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (596 mg).

Paso 3: Preparación de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (descrita previamente en el Ejemplo 1 paso 3 en la página 52 del documento WO 2010/089210 A1)

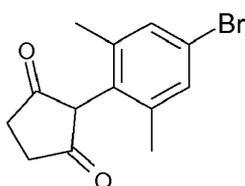


A una solución de 5-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (18.33 g, 65 mmol) en acetona (200 mL) a 0 °C, se añade, gota a gota, una solución del reactivo de Jones (1.67 M, 39 mL, 65 mmol) y la solución amarilla resultante se agita a 0 °C durante 90 minutos. La reacción se desactiva mediante la adición de propan-2-ol (1 mL) y se agita durante 2 horas más. Se añade salmuera (300 mL) y la reacción se extrae con acetato de etilo (3 x 250 mL). Los extractos orgánicos se combinan, se lavan con salmuera, se secan con sulfato de magnesio anhidro, se filtran y se concentra el filtrado a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (17.2 g).

Paso 4: Preparación de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)ciclopentan-1,3-diona

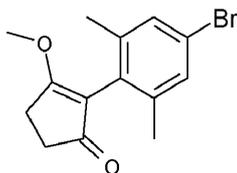


también presente como



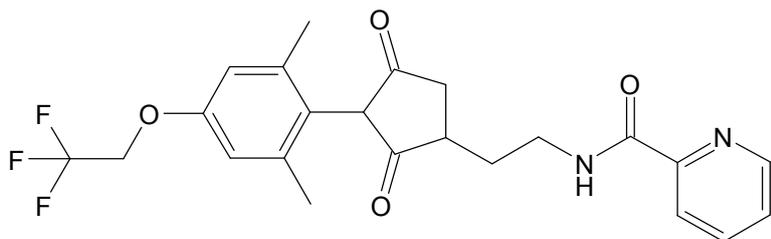
A una solución de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (50 g, 0.18 mol) en ácido acético (2000 mL) a 25-30 °C, se añade zinc en polvo (82.3 g, 1.26 mol). La suspensión resultante se calienta hasta 90 °C durante 2 horas, a continuación se enfría hasta temperatura ambiente y después se filtra a través de un lecho de tierra de diatomeas. El residuo se lava con metanol (100 mL x 2) y la solución se concentra al vacío. Se añade agua destilada y el producto crudo se extrae con acetato de etilo (500 mL x 3). Las fracciones orgánicas se combinan, a continuación se lavan con agua destilada y salmuera, a continuación se secan con sulfato de sodio, se filtran y se concentra el filtrado al vacío para proporcionar 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)ciclopentan-1,3-diona. Este material se utiliza directamente en el siguiente paso sin purificación adicional.

Paso 5: Preparación de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona



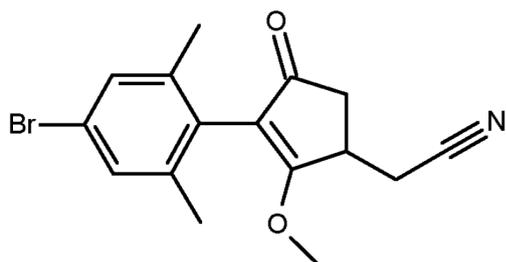
A una solución de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)ciclopentan-1,3-diona (40 g, 0.143 mol) en acetona (2000 mL), se añade carbonato de potasio anhidro (98.5 g, 0.714 mol) y yodometano (45 mL, 0.72 mol). La mezcla resultante se agita a 25-30 °C durante 16 horas, a continuación se eliminan los disolventes volátiles al vacío y el residuo se diluye con agua destilada (200 mL) y se extrae con acetato de etilo (3 x 500 mL). Las fracciones orgánicas se combinan, se lavan con agua destilada y salmuera, a continuación se secan con sulfato de sodio, se filtran y se concentra el filtrado al vacío. El producto crudo se purifica mediante cromatografía flash en columna para proporcionar 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona.

Ejemplo 8: Síntesis del compuesto A126



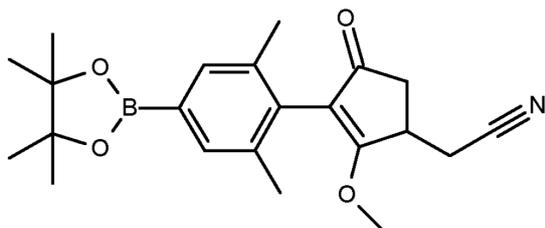
(A126)

Paso uno: Síntesis de 2-[3-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetónitrilo



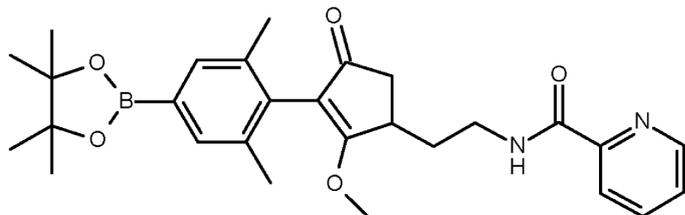
A una solución de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona (11.0 g, 37.3 mmol) (que se puede preparar, p. ej., mediante el método descrito en el Intermedio 2 de la presente) en THF anhidro (90 mL) a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ se añadió hexametildisilazida de potasio (45 mL, 41 mmol, 0.91 mol/L en THF) en 2 min. La mezcla se calentó hasta $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ y se agitó durante 30 min, a continuación se enfrió hasta $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$. Se añadió 2-bromoacetronitrilo (2.90 mL, 41.6 mmol) gota a gota y la mezcla se calentó a continuación hasta $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ y se agitó durante 1 h. Se añadió NH_4Cl acuoso saturado 0.5 M (200 mL) y el THF se eliminó a presión reducida. El residuo se extrajo con acetato de etilo (2×100 mL) y las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (50 mL), después se secaron con MgSO_4 y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (6.42 g, 52%) como un sólido de color marrón pálido. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 7.24 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 3.57 (s, 3H), 3.20 - 3.30 (m, 1H), 2.73 - 2.93 (m, 3H), 2.50 (dd, 1H), 2.21 (s, 3H), 2.12 (s, 3H).

Paso dos: Síntesis de 2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetonitrilo



A una mezcla de 2-[3-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetonitrilo (10.80 g, 32.3 mmol), 4,4,5,5-tetrametil-2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1,3,2-dioxaborolano (11.8 g, 45.8 mmol), acetato de potasio (4.36 g, 44.4 mmol) y SPhos (1.01 g, 2.39 mmol) en 1,4-dioxano (150 mL) se añadió tris(dibencilidena)acetona) dipaladio (0) (1.10 g, 1.20 mmol). La mezcla se desgasificó agitando con burbujeo de nitrógeno durante 10 min, a continuación se calentó a $85\text{ }^{\circ}\text{C}$ durante un total de 4 h y después se enfrió hasta temperatura ambiente. El disolvente se eliminó a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo (80 mL) y se filtró a través de Celite, lavando con agua (50 mL). Las fases se separaron y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (50 mL). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (50 mL), después se secaron con MgSO_4 y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano y el material obtenido se purificó de nuevo lavando con EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (8.78 g, 71%) como un sólido beige. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 7.52 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 3.53 (s, 3H), 3.21 - 3.30 (m, 1H), 2.89 (dd, 1H), 2.74 - 2.85 (m, 2H), 2.50 (dd, 1H), 2.23 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.34 (s, 12H).

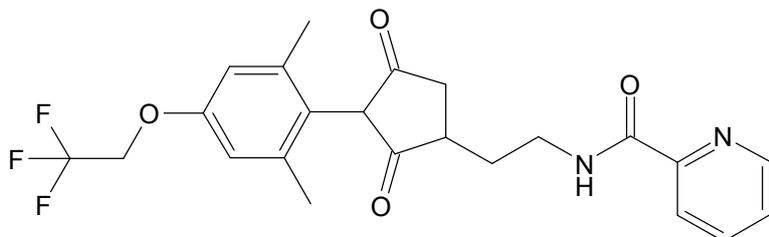
Paso tres: Síntesis de N-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



En un autoclave se introdujeron níquel Raney (2800) (7.3 g), piridin-2-carboxilato de (2,3,4,5,6-pentafluorofenilo) (5.70 g, 19.7 mmol) y 2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetonitrilo (5.00 g, 13.1 mmol) en 1,2-dimetoxietano (125 mL). La mezcla se presurizó a 3.5 Bar con hidrógeno y se agitó vigorosamente a temperatura ambiente, con la adición de más níquel Raney (2800) (2.0 g) en intervalos de 2 h antes de continuar la reacción en las mismas condiciones. Después de un total de 6 h, la mezcla

se filtró a través de Celite™, lavando con dimetoxietano seguido de metanol. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (4.59 g, 71%) como una espuma de color amarillo pálido. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 8.55 (d, 1H), 8.17 - 8.24 (m, 2H), 7.86 (td, 1H), 7.49 (s, 2H), 7.44 (ddd, 1H), 3.58 - 3.69 (m, 2H), 3.49 (s, 3H), 3.02 (dddd, 1H), 2.84 (dd, 1H), 2.38 (dd, 1H), 2.22 - 2.33 (m, 1H), 2.15 (d, 6H), 1.79 (dc, 1H), 1.33 (s, 12H).

Paso cuatro: Síntesis de N-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida (compuesto A126)



Se combinó N-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (100 mg, 0.204 mmol) con acetato de cobre (II) (78 mg, 0.43 mmol) y trietilamina (0.11 mL, 0.79 mmol) en 2,2,2-trifluoroetanol (1.5 mL). La suspensión densa resultante se selló en un vial de microondas, se calentó a 70 °C durante 40 min y después se concentró a presión reducida. El residuo se repartió entre EDTA tetrasódico acuoso 0.5 M (10 mL, 5 mmol) y acetato de etilo (10 mL). Las fases se separaron y la capa orgánica se lavó con EDTA tetrasódico acuoso 0.5 M (10 mL, 5 mmol), agua (10 mL) y salmuera (5 mL). A continuación, la capa orgánica se secó con MgSO₄ y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener una mezcla del producto deseado y el material de partida protodesborilado, que se empleó en el siguiente paso sin purificación adicional. El producto crudo (60 mg) se disolvió en una mezcla de acetona (2 mL) y HCl acuoso 2 M (2 mL) y se calentó a reflujo durante 2 h, después se enfrió hasta temperatura ambiente y se concentró a presión reducida para eliminar la acetona. El pH de la mezcla acuosa se ajustó a 4-5 mediante la adición de NaHCO₃ acuoso saturado y después se extrajo con EtOAc (3 x 5 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se concentraron a presión reducida, y el residuo se purificó mediante HPLC preparativa con fraccionamiento dirigido por masas para obtener el producto deseado (21 mg, 23% en dos pasos) como una goma incolora. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.64 (s a, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.89 (td, 1H), 7.50 (dd, 1H), 6.64 (s, 2H), 4.29 (c, 2H), 3.81 - 4.16 (m, 1H), 3.35 - 3.57 (m, 1H), 2.82 - 3.00 (m, 2H), 2.26 (d, 1H), 2.02 - 2.19 (m, 7H), 1.83 - 2.02 (m, 1H).

Nota general sobre la HPLC preparativa dirigida por masas

Los compuestos se purificaron por HPLC prep. dirigida por masas utilizando ES+ en un sistema Fraction Lynx de Waters que comprendía un inyector/colector 2767 con una bomba de gradiente 2545, dos bombas isocráticas 515, un SFO, un haz de fotodiodos 2998, un ELSD 2424 y un espectrómetro de masas 3100. Se utilizó una precolumna XBridge dC18 de 5 micrones y 19 x 10 mm de Waters con una columna preparativa C18-AR ACE de 5 micrones y 30 x 100 mm de ACT.

La HPLC preparativa se llevó a cabo con un tiempo de análisis de 11.4 minutos utilizando una "dilución en columna", de acuerdo con la siguiente tabla de gradientes:

Para P2_10min_Foc2_0

Tiempo (min)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Flujo (mL/min)
0.00	85	15	33
1.50	85	15	33
1.51	50	50	33
7.0	30	70	33
7.3	0	100	33
9.2	0	100	33
9.8	95	5	33

11.35	95	5	33	
11.40	95	5	33	

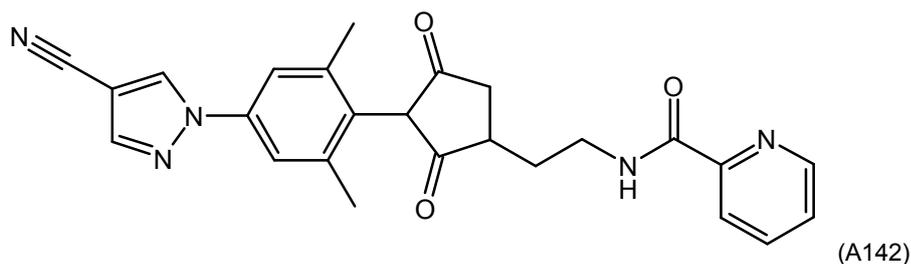
Bomba 515, 2 mL/min de CH₃CN con un 0.05% de TFA

Bomba 515, 2 mL/min de un 90% de MeOH/10% de H₂O (bomba de reposición)

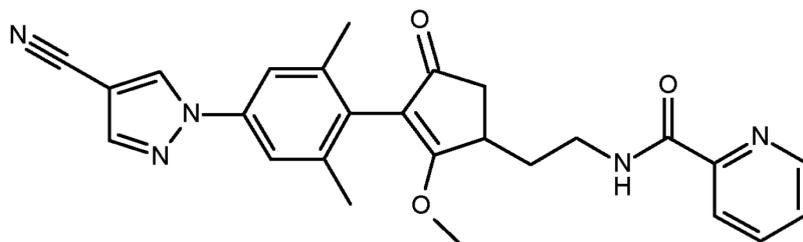
Disolvente A: H₂O con un 0.05% de TFA

Disolvente B: CH₃CN con un 0.05% de TFA

5 Ejemplo 9: Síntesis del compuesto A142

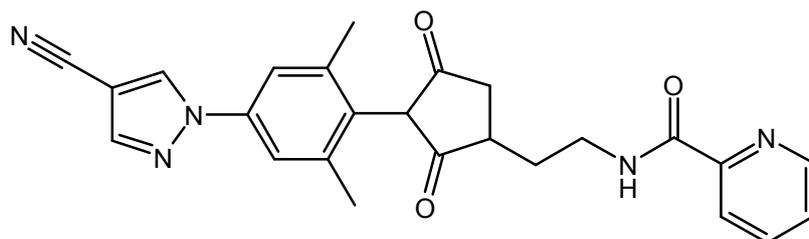


Paso uno: Síntesis de N-[2-[3-[4-(4-cianopirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



- 10 Se combinó N-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (200 mg, 0.408 mmol) con acetato de cobre (II) (230 mg, 1.27 mmol), carbonato de potasio (90 mg, 0.64 mmol) y clorhidrato de 1H-pirazol-4-carbonitrilo (78 mg, 0.60 mmol) en piridina (3 mL). La mezcla se calentó a 80 °C en atmósfera de nitrógeno durante 5 horas en total, después se enfrió hasta temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. El residuo se repartió entre EtOAc (10 mL) y EDTA tetrasódico acuoso
- 15 0.5 M (10 mL, 5 mmol) y la mezcla se filtró a través de Celite. Las fases se separaron y la capa orgánica se lavó con EDTA tetrasódico 0.5 M (5 mL, 2.5 mmol), después se secó con MgSO₄ y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó parcialmente mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano. El material impuro obtenido se redisolvió en EtOAc/éter 1:1 y se lavó con NaOH acuoso 2 M (3 × 10 mL) seguido de salmuera (10 mL). Las capas orgánicas se secaron con MgSO₄ y se concentraron a presión reducida para obtener el
- 20 producto deseado (28 mg, 14%) como una goma incolora. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.55 (d, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.17 - 8.27 (m, 2H), 7.96 (s, 1H), 7.81 - 7.92 (m, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.37 (s, 2H), 3.59 - 3.74 (m, 2H), 3.57 (s, 3H), 3.04 - 3.14 (m, 1H), 2.87 (dd, 1H), 2.42 (dd, 1H), 2.25 - 2.38 (m, 1H), 2.22 (s, 6H), 1.72-1.90 (m, 1H).

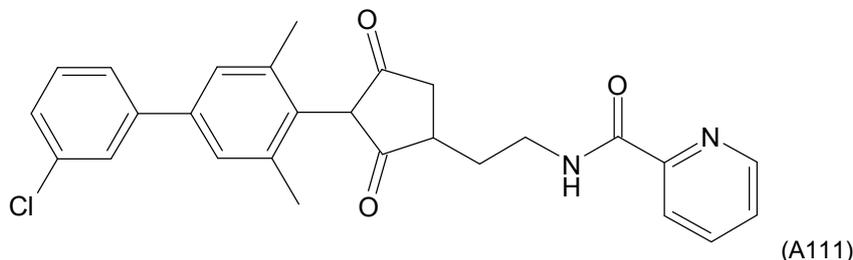
Paso dos: Síntesis de N-[2-[3-[4-(4-cianopirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida (compuesto A142)



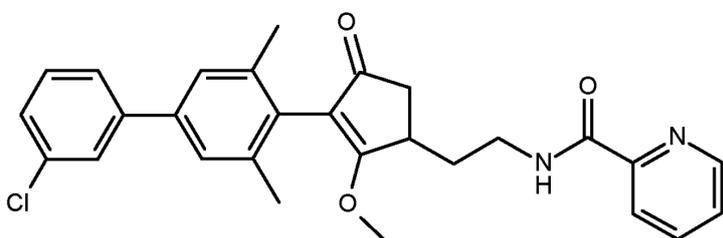
- 25 Preparado de acuerdo con el mismo procedimiento empleado para preparar A1 (paso 5) para obtener el producto deseado (26 mg, 96%) como un vidrio incoloro. ¹H RMN (500 MHz, d₄-metanol) δ (delta) 8.84 (s, 1H), 8.62 (s a, 1H),

8.10 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.95 (t, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.48 (s, 2H), 3.54-3.68 (m, 2H), 2.99 (dd, 1H), 2.81-2.90 (m, 1H), 2.55 (dd, 1H), 2.20-2.27 (m, 1H), 2.18 (s, 6H), 1.79 (ddt, 1H).

Ejemplo 10: Síntesis del compuesto A111

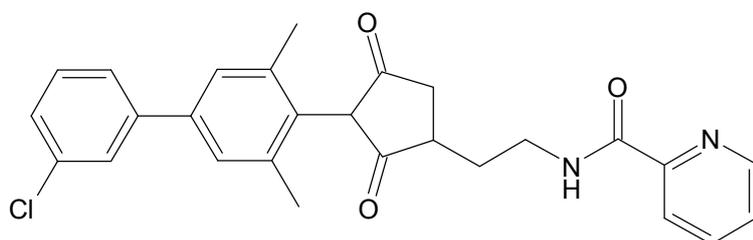


5 Paso uno: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-(3-clorofenil)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



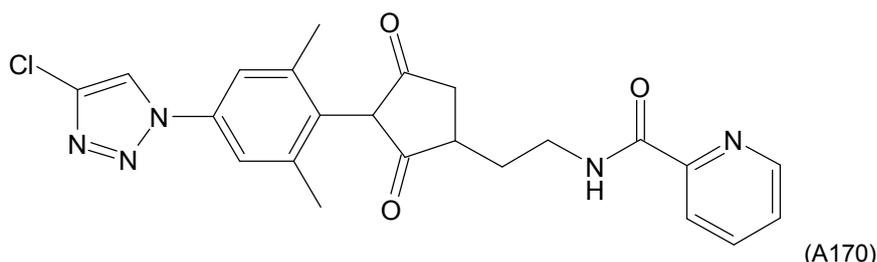
Se combinó *N*-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (50 mg, 0.10 mmol) con dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) (7.5 mg, 0.010 mmol), fosfato de tripotasio (87 mg, 0.41 mmol) y 1-bromo-3-clorobenceno (29 mg, 0.15 mmol) en una mezcla de 1,2-dimetoxietano (1 mL) y agua (0.3 mL) en un vial de microondas. La mezcla se agitó rápidamente y se desgasificó burbujeando nitrógeno durante 2 min, a continuación el vial se selló y se calentó en el microondas a 150 °C durante 30 min. La mezcla se repartió entre diclorometano (10 mL) y agua (5 mL), y después la mezcla se hizo pasar a través de un filtro sinterizado de PTFE para recoger el extracto de diclorometano. Este se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (32 mg, 66%) como una goma rosa. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 8.55 (d, 1H), 7.17 - 8.28 (m, 2H), 7.87 (td, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.41 - 7.47 (m, 2H), 7.31 - 7.37 (m, 1H), 7.27 - 7.31 (m, 1H), 7.24 (s, 2H), 3.61 - 3.69 (m, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.02 - 3.10 (m, 1H), 2.87 (dd, 1H), 2.41 (dd, 1H), 2.25 - 2.36 (m, 1H), 2.21 (s, 6H), 1.72 - 1.89 (m, 2H).

20 Paso dos: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-(3-clorofenil)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida (compuesto A111)

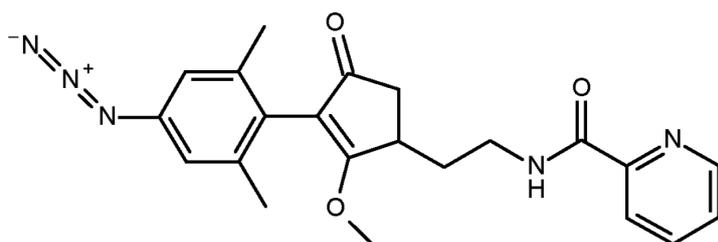


Se disolvió *N*-[2-[3-[4-(3-clorofenil)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (30 mg, 0.063) en morfolina (0.5 mL, 6 mmol) y la mezcla se calentó en atmósfera de nitrógeno a 105 °C durante 75 min. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, después se repartió entre éter (5 mL) y agua (10 mL), y la mezcla bifásica se filtró a través de Celite. Tras separar las fases, el pH de la fase acuosa se ajustó a 5 mediante la adición de ácido clorhídrico HCl (ac.) acuoso 2 M gota a gota y después se extrajo con EtOAc (3 x 5 mL). Las capas de EtOAc combinadas se secaron con MgSO₄ y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (27 mg, 93%) como una goma marrón. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.62 (s a, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.88 (t, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.29 - 7.36 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.24 (s, 2H), 4.01 (s a, 1H), 3.37 - 3.57 (m, 1H), 2.81 - 3.03 (m, 2H), 2.26-2.34 (m, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.10 (s a, 1H), 1.98 (s a, 1H).

Ejemplo 11: Síntesis del compuesto A170

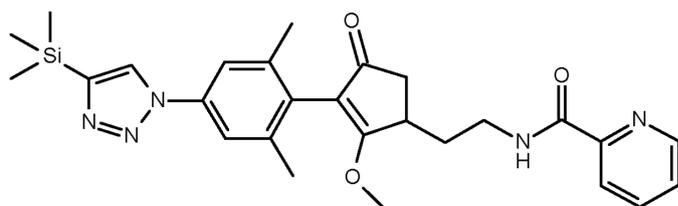


Paso uno: Síntesis de *N*-[2-[3-(4-azido-2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



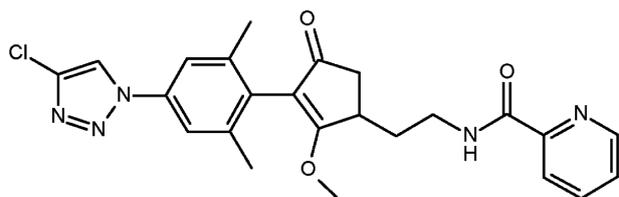
- 5 A una mezcla de azida sódica (63 mg, 0.97 mmol) y *N*-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (500 mg, 1.02 mmol) en metanol (5 mL) se añadió acetato de cobre (II) (18 mg, 0.10 mmol). La mezcla resultante se agitó expuesta al aire a 55 °C durante 6 h en total y después se enfrió hasta temperatura ambiente. La mezcla se repartió entre EDTA tetrasódico acuoso 0.5 M (50 mL, 25 mmol) y acetato de etilo (50 mL). Las fases se separaron y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (2 x 10 25 mL). Las capas orgánicas combinadas se lavaron secuencialmente con EDTA tetrasódico acuoso 0.5 M (25 mL, 12.5 mmol), agua (25 mL) y a continuación salmuera (25 mL), después se secaron con MgSO₄ y se concentraron a presión reducida. El residuo crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (330 mg, 84%) como una goma de color amarillo pálido. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 8.55 (d, 1H), 8.15 - 8.25 (m, 2H), 7.87 (td, 1H), 7.45 (ddd, 1H), 6.73 (s, 2H), 3.64 (cd, 2H), 3.54 (s, 3H), 2.98 - 3.07 (m, 1H), 2.84 (dd, 1H), 2.38 (dd, 1H), 2.23 - 2.33 (m, 1H), 2.13 (s, 6H), 1.72 - 1.84 (m, 1H).

Paso dos: Síntesis de *N*-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4-trimetilsililtriazol-1-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



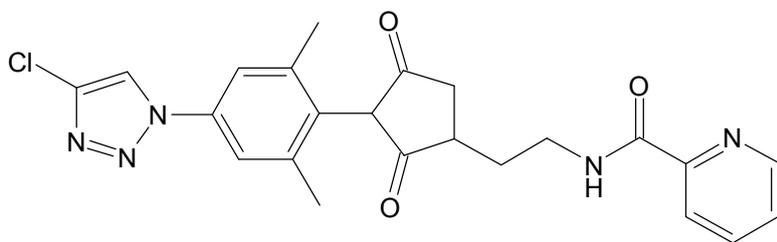
- 20 Se desgasificó una mezcla de *N*-[2-[3-(4-azido-2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (93 mg, 0.23 mmol), *N,N*-diisopropiletilamina (0.13 mL, 0.75 mmol) y yoduro cuproso (7 mg, 0.04 mmol) en THF (2 mL) en un vial de microondas burbujeando nitrógeno durante 2 min. A continuación, se añadió etinil(trimetil)silano (0.70 mL, 5.0 mmol) y la mezcla se calentó en el microondas a 120 °C durante 45 min. La mezcla se concentró a presión reducida, después el residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (48 mg, 42%) como un vidrio de color amarillo pálido. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.56 (d, 1H), 8.16-8.28 (m, 2H), 7.82 - 7.93 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.43 (s, 2H), 3.61 - 3.72 (m, 2H), 3.57 (s, 3H), 3.02 - 3.13 (m, 1H), 2.88 (dd, 1H), 2.42 (dd, 1H), 2.26 - 2.37 (m, 1H), 2.23 (s, 6H), 1.78 - 1.87 (m, 1H), 0.37 (s, 9H).

Paso tres: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-(4-clorotriazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



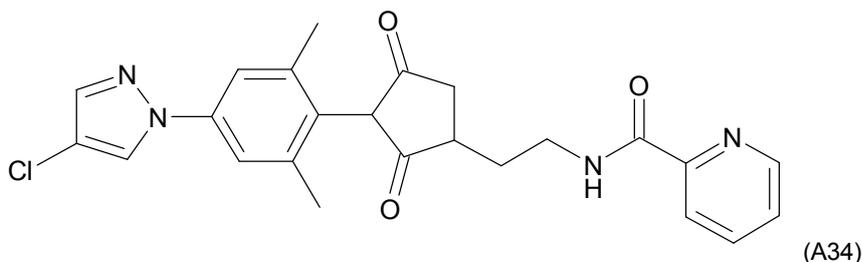
Se combinó *N*-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4-trimetilsililtriazol-1-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (61 mg, 0.12 mmol) con *N*-clorosuccinimida (97 mg, 0.73 mmol) y gel de sílice (255 mg, 4.24 mmol) en acetonitrilo (1 mL). La mezcla se calentó a reflujo durante 90 min y a continuación se enfrió hasta temperatura ambiente. Se añadió Celite™ (200 mg) y la mezcla se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el compuesto deseado (33 mg, 58%) como una goma de color amarillo pálido. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.56 (d, 1H), 8.14 - 8.31 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.88 (td, 1H), 7.46 (ddd, 1H), 7.40 (s, 2H), 3.65 (dd, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.03 - 3.14 (m, 1H), 2.88 (dd, 1H), 2.43 (dd, 1H), 2.27 - 2.37 (m, 1H), 2.24 (s, 6H), 1.76 - 1.87 (m, 1H).

10 **Paso cuatro: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-(4-clorotriazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida (compuesto A170)**

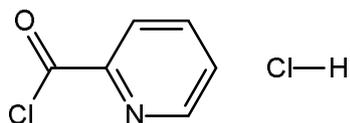


Preparado de acuerdo con el mismo procedimiento empleado para preparar A1 (paso 5) para obtener el producto deseado (33 mg, 100%) como una goma de color amarillo pálido. ¹H RMN (500 MHz, d₄-metanol) δ (delta) 8.61 (d, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.94 (t, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.49 (s, 2H), 3.56 - 3.67 (m, 2H), 3.00 (dd, 1H), 2.83 - 2.91 (m, 1H), 2.56 (dd, 1H), 2.20 - 2.28 (m, 1H), 2.18 (s, 6H), 1.74 - 1.86 (m, 1H).

Ejemplo 12 – Síntesis del compuesto A34

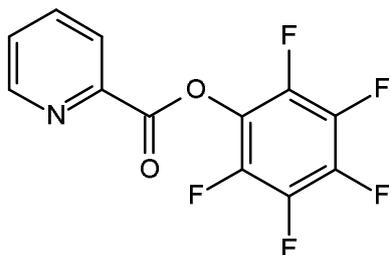


Paso uno: Síntesis del clorhidrato de cloruro de piridin-2-carbonilo



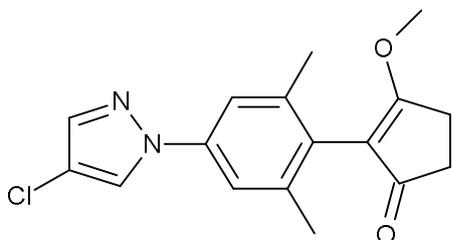
Se añadió DMF (13 mmol, 0.94 g, 1 mL) a una suspensión del ácido piridin-2-carboxílico (181.14 mmol, 22.3 g) en cloruro de tionilo (60 mL) y se agitó durante 3 horas. Se eliminó el exceso de cloruro de tionilo a presión reducida para obtener un sólido de color morado oscuro.

Paso dos: Síntesis de piridin-2-carboxilato de (2,3,4,5,6-pentafluorofenilo)



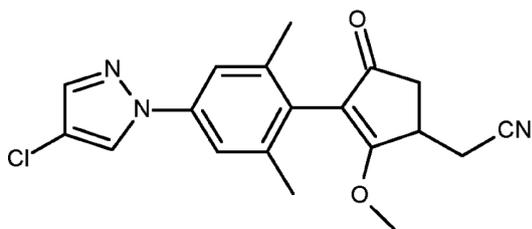
A una suspensión de clorhidrato de cloruro de piridin-2-carbonilo (182.8 mmol, 32.54 g) en THF (1000 mL), en atmósfera de nitrógeno, se añadió 2,3,4,5,6-pentafluorofenol (182.8 mmol, 33.65 g) seguido por la adición de *N,N*-dietiletanamina (548.4 mmol, 55.49 g, 76.4 mL) gota a gota. Tras agitar a temperatura ambiente durante 2 horas, el sólido se separó por filtración a través de Celite y se lavó con acetato de etilo, las capas orgánicas se concentraron a presión reducida para obtener un aceite marrón que se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-30% de acetato de etilo en hexano). El material resultante se purificó además mediante recristalización en hexano para obtener el producto deseado (42.44 g, 80% en 2 etapas) como un sólido blanco. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.63 (ddd, 1H), 7.97 (td, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.88 (dt, 1H).

10 Paso tres: Síntesis de 2-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona



Se creó el vacío en un matraz que contenía 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona (2 g, 6.7755 mmol), 4-cloro-1H-pirazol (1.39 g, 13.551 mmol), carbonato de potasio (2.83 g, 20.3265 mmol) y yoduro de cobre (I) (0.658 g, 3.3878 mmol), y se purgó con nitrógeno. Se añadió clorobenceno (10 mL), seguido de *N,N*-dimetildiamina (0.737 mL, 6.775 mmol) y la reacción se calentó a reflujo (131 °C) durante 1 hora. La reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente, se diluyó con cloroformo (25 mL) y se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL). La capa acuosa se acidificó hasta pH 5 con HCl 2 N y se volvió a extraer con cloroformo. Las capas orgánicas combinadas se filtraron a través de un filtro sinterizado de PTFE, se concentraron al vacío y se diluyeron con acetona (10 mL). Se añadieron carbonato de potasio (1.89 g, 13.55 mmol) y yodometano (0.844 mL, 13.55 mmol) a la solución anterior, y la reacción se agitó durante 4 horas a temperatura ambiente. La reacción se diluyó con cloroformo (25 mL), se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL) y se filtró a través de un filtro sinterizado de PTFE. El filtrado se colocó en seco sobre sílice, se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 20-100% de EtOAc en hexano) para obtener 2-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona (1.61 g, 5.08 mmol, 75.0% de rendimiento) como un sólido blanco. ¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7.87 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.34 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 2.93 - 2.79 (m, 2H), 2.73 - 2.61 (m, 2H), 2.20 (s, 6H).

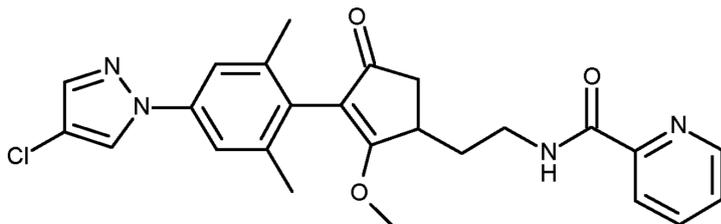
25 Paso cuatro: Síntesis de 2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetonitrilo



En un matraz de 3 bocas secado en una estufa se introdujo 2-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-3-metoxiciclopent-2-en-1-ona (869 mg, 2.74 mmol), se purgó con nitrógeno y se añadió THF (8.69 mL). La reacción se enfrió hasta -65 °C y se añadió LiHMDS (1 M en THF) (3.0175 mL, 3.0175 mmol) gota a gota durante un periodo de 2 minutos y la reacción se dejó agitar durante 20 minutos. A continuación, se añadió una solución de 2-bromoacetonitrilo (395 mg, 3.2918 mmol) en THF (1.738 mL) gota a gota, y la reacción se dejó agitar durante 60

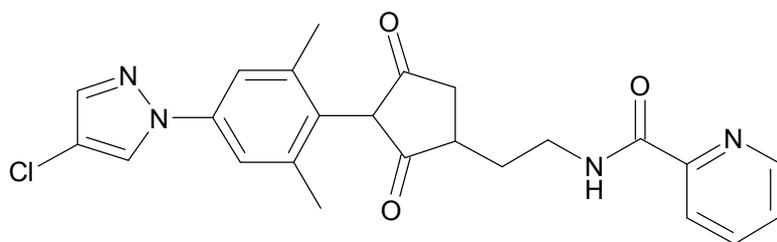
minutos más, antes de dejarla calentar hasta temperatura ambiente durante un periodo de 40 minutos. La reacción se desactivó mediante la adición de solución de cloruro de amonio acuoso saturado (25 mL) y la reacción se dejó agitar durante 10 minutos más. La reacción se extrajo con EtOAc (2 x 25 mL). Las capas orgánicas combinadas se filtraron a través de un filtro sinterizado de PTFE, se colocaron en seco sobre sílice y se purificaron mediante cromatografía flash (0-100% de EtOAc en hexano) para obtener 2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]acetonitrilo (854 mg, 2.40 mmol, 87.5% de rendimiento) como un sólido beige. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 2.21 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.52 (dd, 1H), 2.76 - 2.95 (m, 3H), 3.28 (dd, 1H), 3.60 (s, 3H), 7.36 (s, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.89 (s, 1H).

Paso cinco: Síntesis de N-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



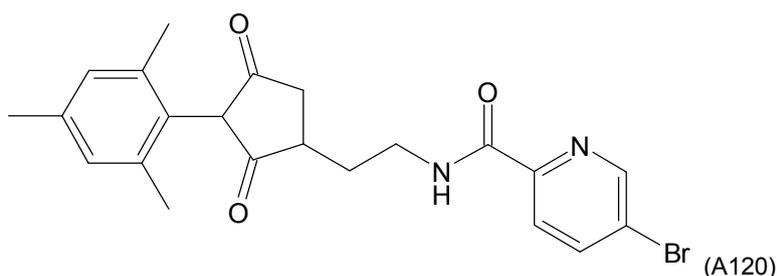
En un recipiente de presión de vidrio se introdujo níquel Raney (2400) (45.615 mmol, 4 g) el cual se lavó con agua destilada (3 x 10 mL) y el exceso de agua se eliminó por decantación. A continuación, se añadieron 2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetonitrilo (2 g, 5.621 mmol), piridin-2-carboxilato de (2,3,4,5,6-pentafluorofenilo) (2.276 g, 7.870 mmol) y 1,2-dimetoxietano (20 mL). El recipiente se selló, se purgó con nitrógeno y a continuación hidrógeno, y después se agitó vigorosamente a temperatura ambiente a 4 bar de hidrógeno durante 3 horas. La reacción se filtró a través de un lecho de Celite, se colocó en seco sobre sílice y se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 10-100% de EtOAc en hexano) para obtener N-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (1.939 g, 4.171 mmol, 74.2% de rendimiento) como un sólido blanco. ¹HRMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 1.74 - 1.87 (m, 1H), 2.21 (s, 6H), 2.26 - 2.36 (m, 1H), 2.41 (dd, 1H), 2.86 (dd, 1H), 3.01 - 3.10 (m, 1H), 3.56 (s, 3H), 3.65 (cd, 2H), 7.33 (s, 2H), 7.45 (ddd, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.83 - 7.93 (m, 2H), 8.21 (d, 2H), 8.52 - 8.59 (m, 1H).

Paso seis: Síntesis de N-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-4-metoxi-2-oxociclopent-3-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (compuesto A34)

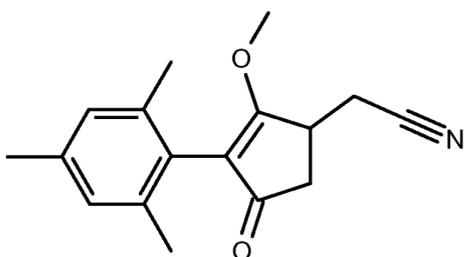


A una solución de N-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (11.2 g, 24.1 mmol) en acetona (112 mL) se añadió HCl 2 N (112 mL) y la reacción se calentó hasta 60 °C durante 17 horas. La reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente, se concentró al vacío para eliminar la acetona en exceso y el pH se ajustó a 4.5 con NaOH 2 N. La capa acuosa se extrajo con EtOAc (2 x 250 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron con Mg₂SO₄, se filtraron a través de un filtro sinterizado de PTFE y se concentraron para obtener N-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida (10.75 g, 23.84 mmol, 98.76% de rendimiento) como un sólido blanco. ¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 12.56 (s a, 1H), 8.71 (s a, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.91 (t, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.57 - 7.49 (m, 1H), 7.34 (s, 2H), 4.24 - 4.09 (m, 1H), 3.46 (s a, 1H), 3.06 - 2.84 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.20 - 2.15 (m, 2H), 1.89 (s a, 1H).

Ejemplo 13: Síntesis del compuesto A120

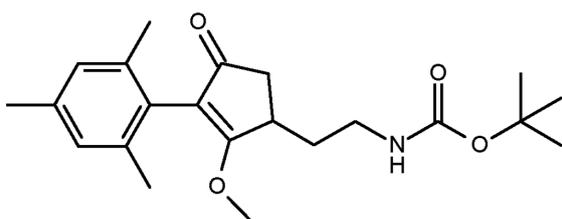


Paso uno: Síntesis de 2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]acetoniitrilo



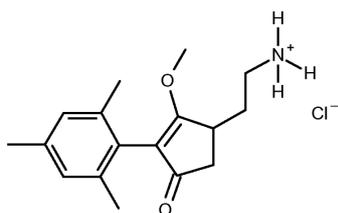
5 A una solución de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-ona (43.420 mmol, 10.0 g) en THF (100 mL), en atmósfera de nitrógeno a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$, se añadió LiHMDS (1 M en THF, 47.762 mL, 47.762 mmol) gota a gota. La temperatura de la reacción se mantuvo por debajo de $-55\text{ }^{\circ}\text{C}$ durante la adición de LiHMDS gota a gota. Tras agitar durante 15 minutos a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$, se añadió 2-bromoacetoniitrilo (52.1 mmol, 6.25 g, 3.63 mL) en THF (20 mL) durante un periodo de 15 minutos. Se continuó agitando a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ durante 40 minutos y después la reacción se calentó hasta temperatura ambiente. Tras detener la reacción con cloruro amónico saturado, se eliminó el disolvente a presión reducida y el material crudo se disolvió en diclorometano y agua. Se separaron las fases y se extrajo la capa acuosa con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, después se secaron con MgSO_4 y el disolvente se eliminó a presión reducida para obtener un aceite marrón. El material crudo se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-100% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (11.136 g, 95%) como un aceite marrón. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) ppm 6.88 (d, 2H), 3.57 (s, 3H), 3.14 - 3.32 (m, 1H), 2.88 (dd, 1H), 2.75 - 2.82 (m, 2H), 2.48 (dd, 1H), 2.23 - 2.34 (m, 3H), 2.14 - 2.22 (m, 3H), 2.06 - 2.14 (m, 3H).

Paso dos: Síntesis de N-[2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]etil]carbamato de *tert*-butilo



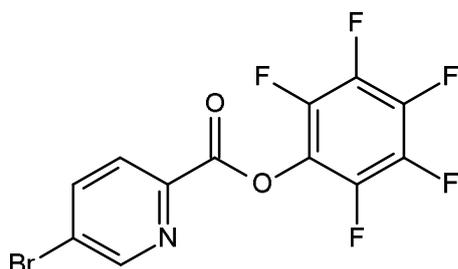
20 A una solución de 2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]acetoniitrilo (3.713 mmol, 1.00 g) en metanol (28 mL) en atmósfera de nitrógeno se añadieron carbonato de *tert*-butoxicarbonilo y *tert*-butilo (7.43 mmol, 1.62 g), y cloruro de níquel (II) (0.668 mmol, 0.0867 g). La mezcla se enfrió hasta $-5\text{ }^{\circ}\text{C}$ en un baño de acetona/hielo seco antes de añadir borohidruro sódico (22.28 mmol, 0.8601 g) en porciones en 30 minutos. Tras agitar durante 1 hora a $-5\text{ }^{\circ}\text{C}$, la reacción se dejó calentar hasta temperatura ambiente y después se agitó durante 3.5 horas más. Se añadió *N*-(2-aminoetil)etano-1,2-diamina (3.713 mmol, 0.3909 g, 0.409 mL) y la mezcla se dejó agitar a temperatura ambiente durante 1 hora. Tras diluir con bicarbonato de sodio saturado y acetato de etilo, las fases se separaron y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, después se secaron con MgSO_4 y el disolvente se eliminó a presión reducida para obtener un aceite marrón. El material crudo se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-75% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (1.167 g, 84%) como un aceite incoloro. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) ppm 6.78 - 6.95 (m, 2H), 4.60 (s a, 1H), 3.44 - 3.63 (m, 3H), 3.14 - 3.36 (m, 2H), 2.86 - 3.04 (m, 1H), 2.68 - 2.85 (m, 1H), 2.22 - 2.37 (m, 4H), 2.01 - 2.16 (m, 6H), 1.36 - 1.71 (m, 10H).

Paso tres: Síntesis de cloruro de 2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]etilamonio



5 A una solución de *N*-[2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]etil]carbamato de *tert*-butilo (15.06 mmol, 5.624 g) en diclorometano (30 mL) a temperatura ambiente se añadió cloruro de hidrógeno (HCl 4 M en 1,4-dioxano, 40 mmol, 10 mL). Tras agitar a temperatura ambiente durante 4 horas, el disolvente se eliminó para obtener un sólido blanquecino que se empleó directamente en la siguiente etapa de la síntesis.

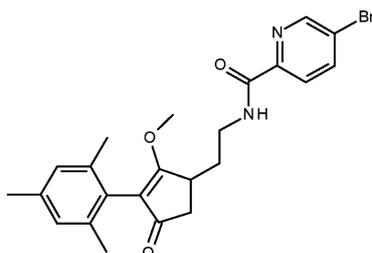
Paso cuatro: Síntesis de 5-bromopiridin-2-carboxilato de (2,3,4,5,6-pentafluorofenilo)



10 A una suspensión del ácido 5-bromopiridin-2-carboxílico (2.48 mmol, 0.500 g) en diclorometano (15 mL) a temperatura ambiente se añadió 2,3,4,5,6-pentafluorofenol (3.09 mmol, 0.569 g) seguido de clorhidrato de 3-(etiliminometileno)-*N,N*-dimetilpropan-1-amina (3.09 mmol, 0.593 g). Después de 2 horas, el disolvente se eliminó a presión reducida y el residuo amarillo se diluyó con acetato de etilo y agua. Se separaron las dos fases resultantes y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, bicarbonato de sodio (saturado) y salmuera, y después se secaron con MgSO₄. Se eliminó el disolvente a presión reducida para obtener el producto deseado (0.894 g, 98%) como un sólido amarillo. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 8.92 (d, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.07 - 8.14 (m, 1H).

15

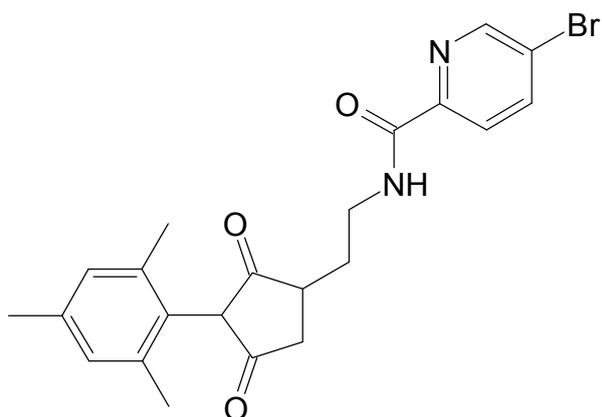
Paso cinco: Síntesis de 5-bromo-*N*-{2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]etil}piridin-2-carboxamida



20 A una solución de trifluoroacetato de 2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]etilamonio (7.502 mmol, 2.906 g) en diclorometano (35 mL) a temperatura ambiente se añadió 5-bromopiridin-2-carboxilato de (2,3,4,5,6-pentafluorofenilo) (8.252 mmol, 3.797 g) seguido de *N,N*-dietiletanamina (33.00 mmol, 4.59 mL). Tras agitar durante 3 horas, el disolvente se eliminó a presión reducida y el residuo crudo se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-85% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (3.462 g, 100%) como una espuma marrón. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 1.68 (s a, 1H), 1.78 (dc, 1H), 2.03 - 2.16 (m, 6H), 2.22 - 2.38 (m, 4H), 2.82 (dd, 1H), 3.00 (dddd, 1H), 3.52 - 3.63 (m, 5H), 6.86 (s, 2H), 7.99 (d, 1H), 8.03 - 8.13 (m, 2H), 8.60 (d, 1H).

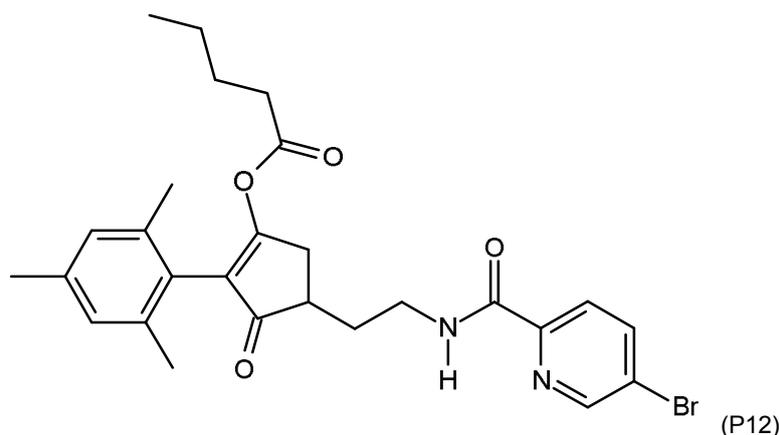
25

Paso seis: Síntesis de 5-bromo-*N*-{2-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentil]etil}piridin-2-carboxamida (compuesto A120)



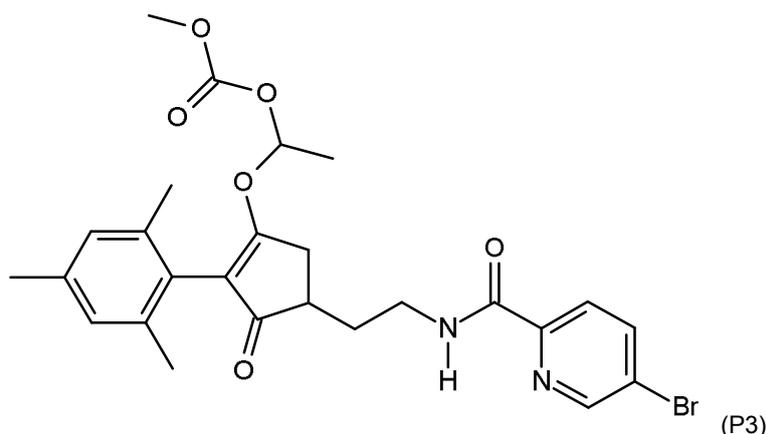
5 A una solución de 5-bromo-*N*-{2-[2-metoxi-4-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-en-1-il]etil}piridin-2-carboxamida (7.569 mmol, 3.462 g) en acetona (35 mL) se añadió cloruro de hidrógeno (50 mmol, 25 mL) y a continuación la mezcla se calentó hasta 65 °C durante la noche. Tras enfriar hasta temperatura ambiente, la acetona se concentró a presión reducida y la solución amarilla resultante se extrajo con diclorometano. Las fracciones orgánicas se concentraron a presión reducida y se purificaron mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-100% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (3.18 g, 94%) como una espuma blanca. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 1.6 - 2.25 (m, 11H), 2.74 - 3.11 (m, 2H), 3.45 (s a, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.97 (s a, 1H), 6.84 (s a, 2H), 7.85 - 8.15 (m, 2H), 8.48 - 8.7 (m, 2H).

10 Ejemplo 14: Síntesis del compuesto P12



15 A una solución agitada de 5-bromo-*N*-{2-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentil]etil}piridin-2-carboxamida (0.11 mmol, 0.050 g) en diclorometano (2 mL) a temperatura ambiente se añadió *N,N*-dietiletanamina (0.12 mmol, 0.013 g) seguida de cloruro de pentanoilo (0.12 mmol, 0.014 g, 0.014 mL). La mezcla se dejó agitar durante la noche. La mezcla de reacción se purificó directamente mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-80% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (47 mg, 79%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 0.82 (t, 3H), 1.10 - 1.31 (m, 2H), 1.43 - 1.58 (m, 2H), 1.78 - 1.93 (m, 1H), 1.96 - 2.11 (m, 6H), 2.14 - 2.41 (m, 6H), 2.67 - 2.92 (m, 2H), 3.27 (dd, 1H), 3.48 - 3.88 (m, 2H), 6.86 (s, 2H), 7.90 - 8.26 (m, 3H), 8.60 (d, 1H).

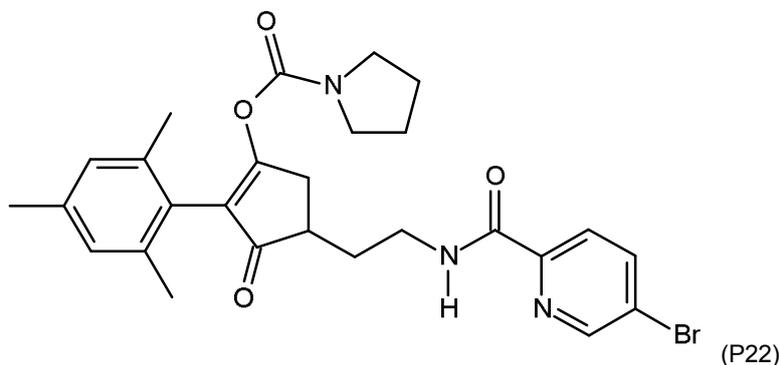
20 Ejemplo 15: Síntesis del compuesto P3



5 A una solución de 5-bromo-*N*-{2-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentil]etil}piridin-2-carboxamida (0.11 mmol, 0.050 g) en DMF (13 mmol, 0.94 g, 1 mL) a temperatura ambiente se añadió carbonato de potasio (0.23 mmol, 0.031 g) y carbonato de 1-cloroetilmetilo (0.23 mmol, 0.031 g). La mezcla se dejó agitar a temperatura ambiente durante 4 días. La mezcla se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo, las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, y se secaron con MgSO₄, se filtraron y se concentraron a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-100% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (50 mg, 81%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 8.47 - 8.70 (m, 1H), 7.88 - 8.23 (m, 3H), 6.73 - 6.95 (m, 2H), 5.71 - 6.32 (m, 1H), 3.52 - 3.83 (m, 4H), 2.33 - 3.30 (m, 3H), 2.27 (s, 4H), 1.98 - 2.10 (m, 6H), 1.67 - 1.91 (m, 2H), 1.30 - 1.57 (m, 3H).

10

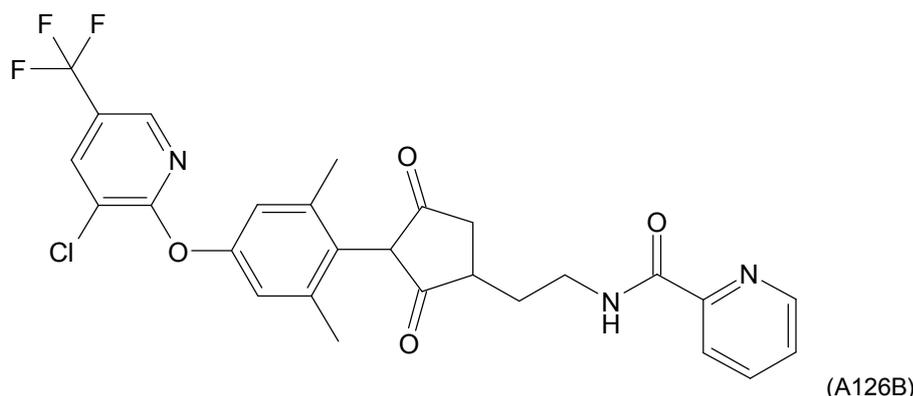
Ejemplo 16: Síntesis del compuesto P22



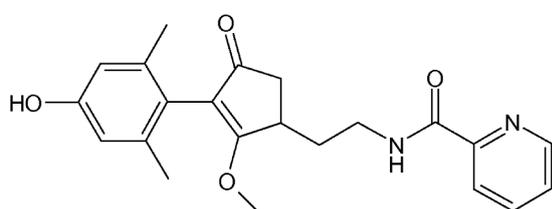
15 A una solución de 5-bromo-*N*-{2-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentil]etil}piridin-2-carboxamida (0.11 mmol, 0.050 g) en diclorometano (2 mL) a temperatura ambiente en un vial de microondas se añadieron cloruro de pirrolidin-1-carbonilo (0.23 mmol, 0.030 g) y la base fosfacínica, P2tBu (1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentakis(dimetilamino)-2λ⁵,4λ⁵-catenadi(fosfaceno)) (2 M en THF, 0.10 mmol, 0.050 mL). La reacción se calentó a 100 °C durante 30 minutos. La mezcla de reacción se purificó directamente mediante cromatografía flash (gradiente de elución: 0-80% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (22 mg, 36%) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 1.86 (d, 4H), 2.01 - 2.14 (m, 6H), 2.26 (s, 4H), 2.67 - 3.12 (m, 2H), 3.14 - 3.50 (m, 6H), 3.52 - 3.84 (m, 2H), 6.86 (s, 2H), 7.85 - 8.23 (m, 3H), 8.60 (d, 1H).

20

Ejemplo 16A: Síntesis del compuesto A126B

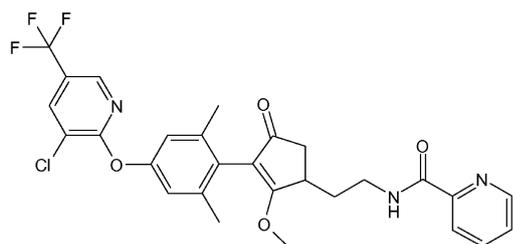


Paso uno: Síntesis de *N*-[2-[3-(4-hidroxi-2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



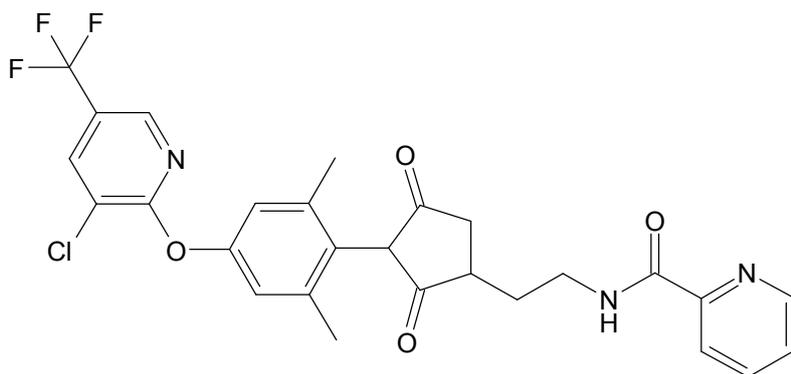
- 5 Una solución acuosa de peróxido de hidrógeno (1.1 g, 9.7 mmol, 30% en masa) se añadió a una suspensión agitada de *N*-[2-[3-[2,6-dimetil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (500 mg, 1.02 mmol) en metanol (10 mL). Después de 20 horas, se añadió una solución de metabisulfito de sodio (20 mL, 10 mmol, 0.5 mol/L) gota a gota a la mezcla de reacción con agitación rápida. Se eliminó el metanol a presión reducida, a continuación la mezcla se repartió con acetato de etilo (20 mL). Las fases se separaron y a continuación la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (2 x 10 mL). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera (10 mL), después se secaron con MgSO₄ y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (360 mg, 93%) como una espuma blanca. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.49-8.61 (m, 1H), 8.15-8.28 (m, 2H), 7.8 (td, 1H), 7.44 (dddd, 1H), 6.44 (s, 1H), 3.60 - 3.69 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 3.01 (dddd, 1H), 2.85 (dd, 1H), 2.39 (dd, 1H), 2.22 - 2.32 (m, 1H), 2.03 (s, 6H), 1.73 - 1.84 (m, 1H).
- 10
- 15

Paso dos: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil]oxi]-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida



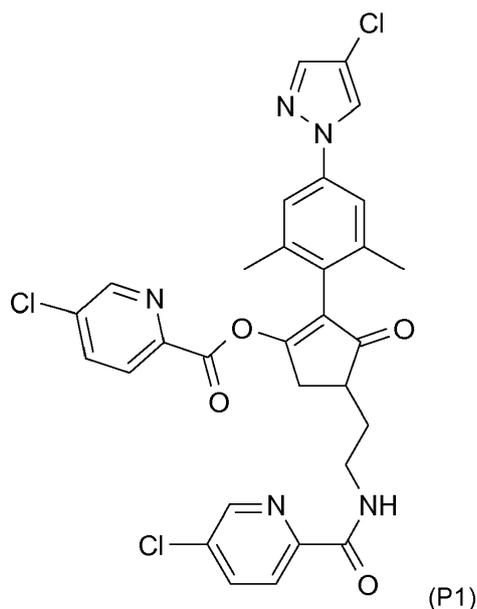
- 20 Se combinó *N*-[2-[3-(4-hidroxi-2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida (101 mg, 0.266 mmol) con 3-cloro-2-fluoro-5-(trifluorometil)piridina (66 mg, 0.33 mmol) y carbonato de potasio (74 mg, 0.53 mmol) en sulfóxido de dimetilo (1 mL). La mezcla se calentó a 60 °C con agitación durante 30 min y después se enfrió hasta temperatura ambiente. La mezcla se repartió entre acetato de etilo (15 mL) y agua (10 mL). Las fases se separaron y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (5 mL). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua (2 x 5 mL) seguida de salmuera (5 mL), después se filtraron a través de un filtro sinterizado de PTFE y se concentraron a presión reducida. El residuo crudo se purificó mediante cromatografía flash en sílice utilizando un gradiente de EtOAc/hexano para obtener el producto deseado (141 mg, 95%) como una goma incolora. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (delta) 8.56 (d, 1H), 8.17 - 8.25 (m, 2H), 7.96 (d, 1H), 7.87 (td, 1H), 7.45 (ddd, 1H), 6.87 (s, 2H), 3.65 (cd, 2H), 3.59 (s, 3H), 3.05 (dddd, 1H), 2.85 (dd, 1H), 2.40 (dd, 1H), 2.25 - 2.36 (m, 1H), 2.16 (s, 6H), 1.73 - 1.85 (m, 1H).
- 25

- 30 **Paso tres: Síntesis de *N*-[2-[3-[4-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil]oxi]-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridin-2-carboxamida (compuesto A126B)**

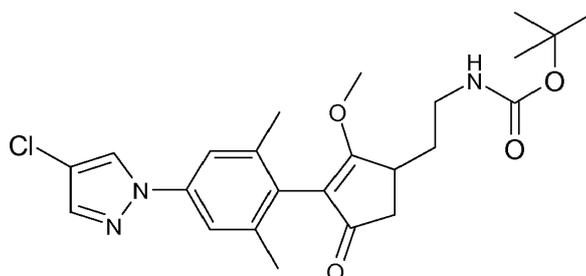


- 5 El compuesto anterior se preparó a partir de N-[2-[3-[4-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil]oxi]-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]piridin-2-carboxamida, de acuerdo con un procedimiento sustancialmente similar al utilizado para preparar el compuesto A1 (Ejemplo 1, paso 5) para obtener el producto deseado (103 mg, 91%) como una espuma incolora. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 8.69 (s a, 1H), 8.60 (s a, 1H), 8.27 (s a, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.87-7.99 (m, 2H), 7.52 (s a, 1H), 6.87 (s, 2H), 4.13 (d, 1H), 3.45 (d, 1H), 2.98 (s a, 1H), 2.89 (dd, 1H), 2.10 - 2.29 (m, 8H), 1.91 (t, 1H).

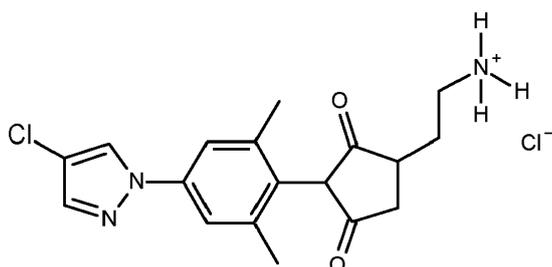
Ejemplo 16B: Síntesis del compuesto P1



- 10 **Paso uno: Síntesis de N-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]carbamato de *tert*-butilo**

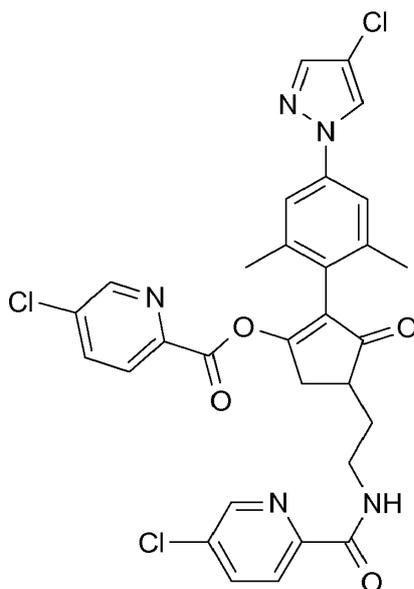


- 15 Se preparó a partir de 2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]acetonitrilo de acuerdo con sustancialmente el mismo procedimiento utilizado para preparar A120 (paso 2) con el fin de obtener el producto deseado (194 mg, 30%) como una goma de color amarillo pálido. ^1H RMN (500 MHz, CDCl_3 y unas gotas de d_4 -metanol) δ (delta) 7.88 (m, 1 H), 7.62 (s, 1 H), 7.34 (s, 2H), 4.59 - 4.75 (m, 1 H), 3.57 (s, 5H), 3.03 - 3.19 (m, 1 H), 2.65 - 2.80 (m, 1 H), 2.33 - 2.48 (m, 1 H), 2.22 (d, 6H), 1.45 (s, 10H).

Paso dos: Síntesis de cloruro de 2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etilamonio (Intermedio 3)

5 A una solución de *N*-[2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]carbamato de *tert*-butilo (0.100 g, 0.224 mmol) en acetona (2 mL), se añadió HCl 2 M (2 mL). La mezcla de reacción se calentó hasta 120 °C con irradiación de microondas durante 20 minutos, tras lo cual se diluyó con diclorometano y se separaron las fases. La fase acuosa se evaporó a sequedad para obtener el producto deseado (Intermedio 3) (0.085 g, 99%) como un cristal blanquecino. ¹H RMN (500 MHz, D₂O) δ (delta) ppm 7.89 (s, 1H), 7.58 (s, 1 H), 7.09 (m, 2H), 3.11 (m, 2H), 3.00 (m, 1 H), 2.88 (m, 1 H), 2.50 (m, 1 H), 2.11 (m, 1 H), 1.99 (s, 6H), 1.86 (m, 1 H).

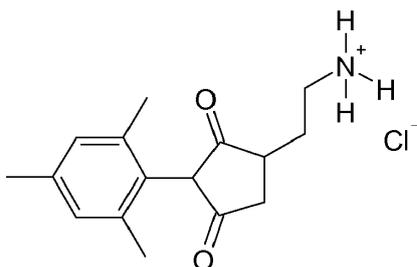
10 Nota: La sal de HCl mostrada anteriormente de la amina (R-NH₃⁺ Cl⁻) (Intermedio 3), producida en el proceso anterior, se puede convertir en la correspondiente amina libre (R-NH₂) si se desea, p. ej., mediante una columna de intercambio iónico.

Paso tres: Síntesis de 5-cloropiridin-2-carboxilato de [2-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-4-[2-[(5-cloropiridin-2-carbonil)amino]etil]-3-oxociclopenten-1-ilo] (compuesto P1)

15 A una solución de cloruro de 2-[3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etilamonio (p. ej., Intermedio 3) (0.172 mmol, 0.066 g) en diclorometano (5 mL), se añadió trietilamina (1.7 mmol, 0.98 mL) y cloruro de 5-cloropiridin-2-carbonilo (1.1 mmol, 0.19 g). Después de agitar durante 1 hora a temperatura ambiente, la reacción se absorbió en sílice y se purificó mediante cromatografía flash (elución en gradiente: 0-100% de acetato de etilo en hexano) para obtener el producto deseado (0.059 g, 55%) como un aceite naranja. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ (delta) ppm 8.39 - 8.74 (m, 2H), 8.04 - 8.23 (m, 2H), 7.48 - 7.98 (m, 5H), 7.20 - 7.42 (m, 2H), 3.32 - 3.88 (m, 3H), 2.88 - 3.21 (m, 2H), 2.06 - 2.37 (m, 7H), 1.84 - 2.00 (m, 1 H).

20

Intermedio 4: Síntesis de cloruro de 2-[3-(2,4,6-trimetilfenil)-2,4-dioxociclopentil]etilamonio



Utilizando procedimientos similares a los descritos en el Ejemplo 16B pasos 1 y 2 para preparar el Intermedio 3, el compuesto intermedio mostrado anteriormente (Intermedio 4) se puede preparar a partir de *N*-[2-[3-(2,4,6-trimetilfenil)-2-metoxi-4-oxociclopent-2-en-1-il]etil]carbamato de *tert*-butilo.

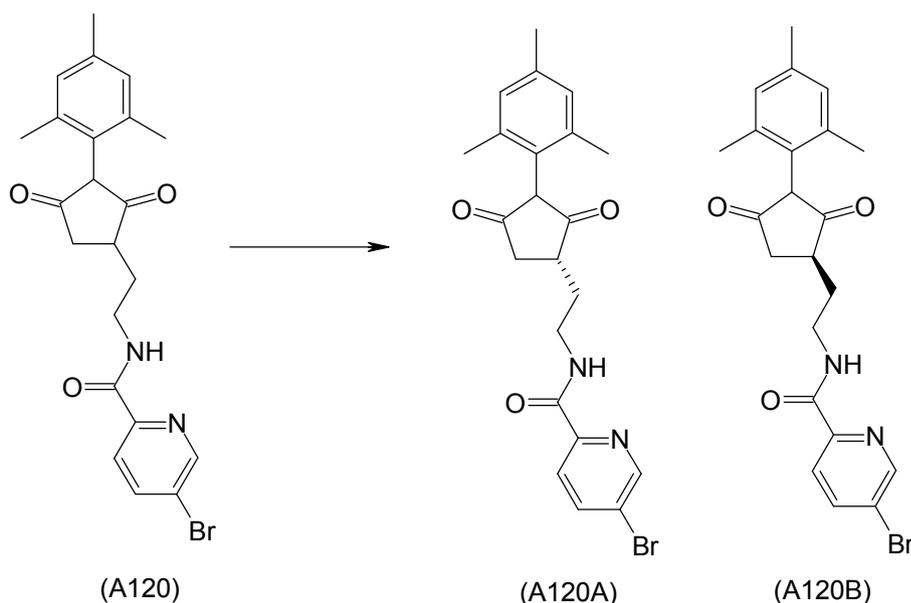
- 5 Nota: La sal de HCl mostrada anteriormente de la amina (R-NH₃⁺ Cl⁻) (Intermedio 4) se puede convertir opcionalmente en la correspondiente amina libre (R-NH₂) si se desea, p. ej., mediante una columna de intercambio iónico.

OTROS EJEMPLOS DE HPLC QUIRAL

10 Ejemplo 17 – Neutralización y eliminación de la sal trifluoroacetato introducida en A98 durante la HPLC quiral

Se suspendió trifluoroacetato de *N*-[2-[(1*R*)-3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridinio-2-carboxamida (54.36 g) en agua (500 mL) y EtOAc (50 mL). Se añadió cuidadosamente bicarbonato de sodio en porciones a la mezcla hasta alcanzar pH 5.0. La solución se extrajo con EtOAc (500 mL). La capa acuosa se reacidificó hasta pH 5.0 utilizando HCl 2 N y se extrajo con EtOAc (500 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄, se filtraron a través de un filtro sinterizado de PTFE y se concentraron al vacío para obtener *N*-[2-[(1*R*)-3-[4-(4-cloropirazol-1-il)-2,6-dimetilfenil]-2,4-dioxociclopentil]etil]piridinio-2-carboxamida (43.63 g, 96.76 mmol) como un sólido beige.

15 Ejemplo 18 - Separación por HPLC quiral de los enantiómeros del compuesto A120 (compuestos A120A y A120B)



20 El compuesto A120 (racémico) se separó en los compuestos enantiómeros A120A y A120B, y utilizando una columna de SFC quiral, mediante el siguiente método y en las siguientes condiciones.

La columna de SFC quiral empleada fue una columna de SFC Chiralpak® AD de 5 micrones y 20 mm x 250 mm, fabricada por Daicel. En esta columna, la fase estacionaria quiral es tris(3,5-dimetilfenilcarbamato) de amilosa.

25 El sistema de disolventes empleado como eluyente para la columna fue una mezcla 30:70 (en volumen) del Disolvente A y el Disolvente B, en la que:

el Disolvente A es metanol

y el Disolvente B es dióxido de carbono supercrítico.

Otras condiciones eran las siguientes:

Flujo a través de la columna: 50 mL/minuto.

Carga (compuesto colocado sobre la columna): 20 mg/mL en metanol:acetonitrilo (50:50).

5 Volumen de muestra (compuesto) inyectado por análisis = 1.0 mL.

Número de inyecciones del compuesto = 17.

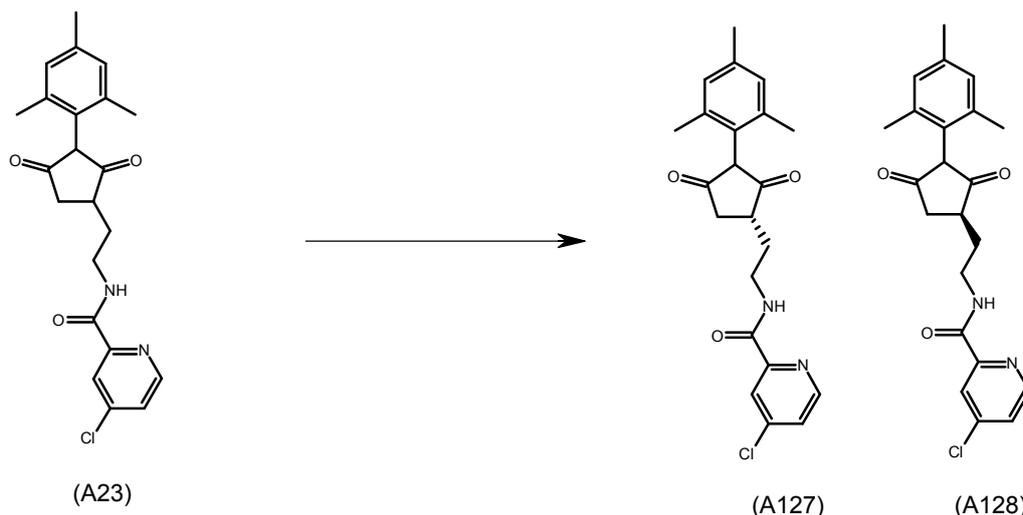
Duración del análisis = 6 minutos.

Longitud de onda de la detección = 245 nm.

10 La SFC quiral de un total de 340 mg del compuesto A120 en las condiciones anteriores proporcionó 126 mg del compuesto A120A (con un 100% de exceso enantiomérico (e.e.) y un tiempo de retención de 2.57 minutos en las condiciones anteriores) y 84 mg del compuesto A120B (con un 98.5% de exceso enantiomérico (e.e.) y un tiempo de retención de 3.18 minutos en las condiciones anteriores).

Abreviatura: SFC = cromatografía de fluidos supercríticos

Ejemplo 19 - Separación por HPLC quiral de los enantiómeros del compuesto A23 (compuestos A127 y A128)



El compuesto A23 (racémico) se separó en los compuestos enantiómeros A127 y A128 utilizando una columna de HPLC quiral, mediante el siguiente método y en las siguientes condiciones.

20 La columna de HPLC quiral empleada era una columna de HPLC (s,s) WhelkO1 de 5 micrones y 20 mm x 250 mm, fabricada por Regis Technologies, Inc. En esta columna, la fase estacionaria quiral es (S,S) 1-(3-5-dinitrobenzamido)-1,2,3,4-tetrahidrofenantreno.

El sistema de disolventes empleado como eluyente para la columna fue una mezcla 50:50 (en volumen) del Disolvente A y el Disolvente B, en la que:

el Disolvente A es isohexano que contiene un 0.1% v/v de isopropanol y un 0.1% v/v de ácido trifluoroacético (TFA), y

25 el Disolvente B es una mezcla 80:20 v/v de isopropanol:metanol.

Otras condiciones eran las siguientes:

Flujo a través de la columna: 50 mL/minuto.

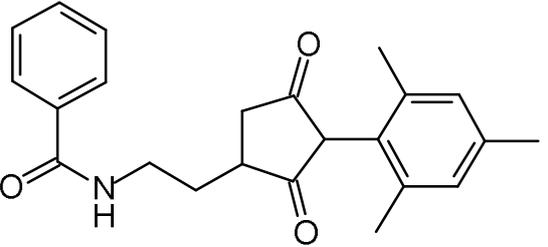
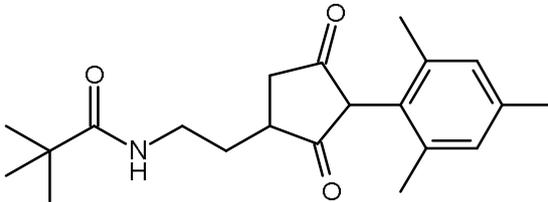
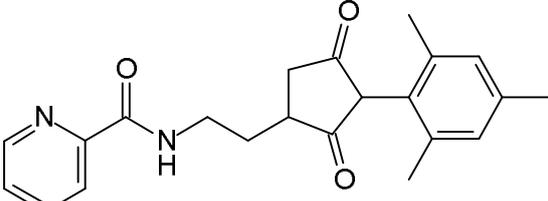
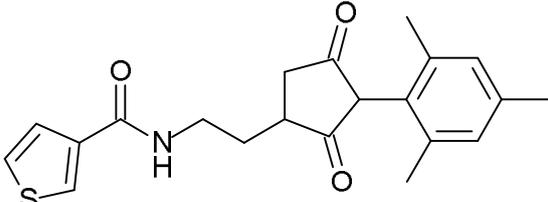
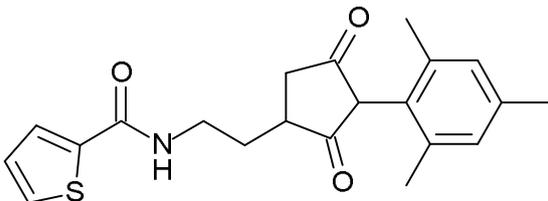
Carga (compuesto colocado sobre la columna): 53 mg/mL en isopropanol.

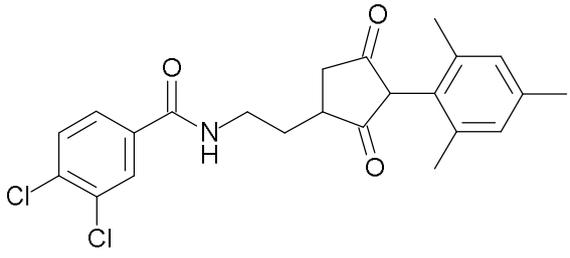
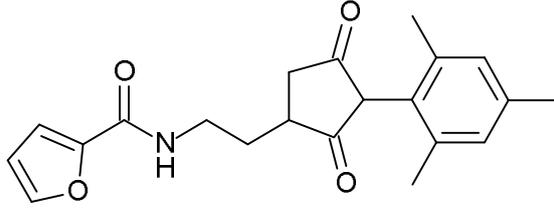
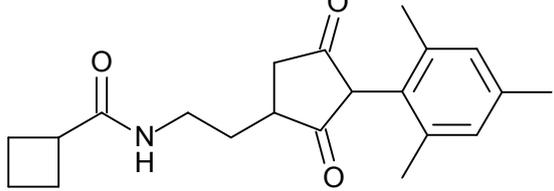
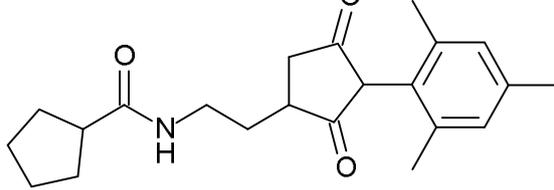
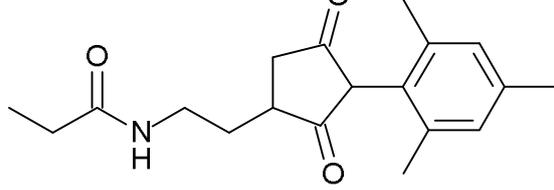
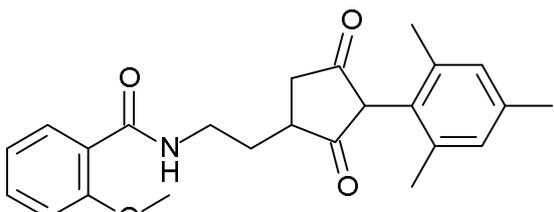
Volumen de muestra (compuesto) inyectado por análisis = 1.0 mL.

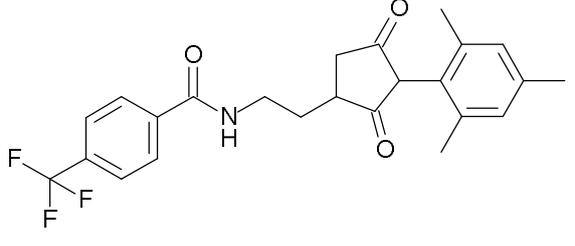
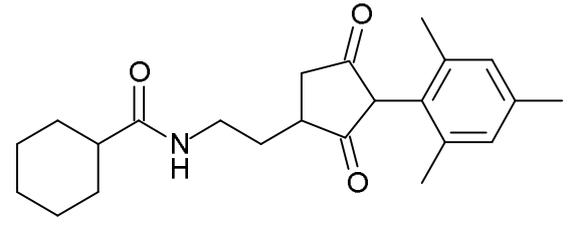
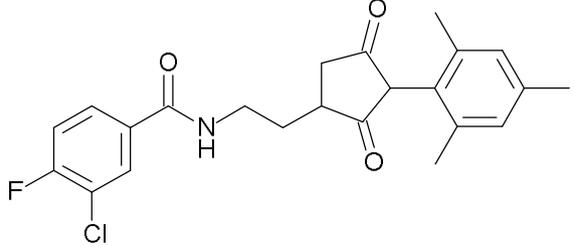
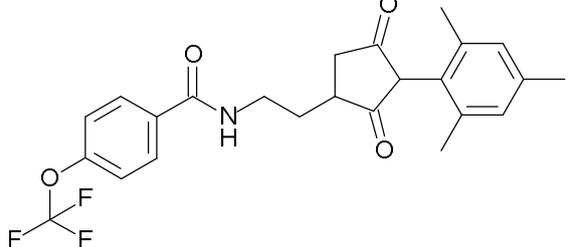
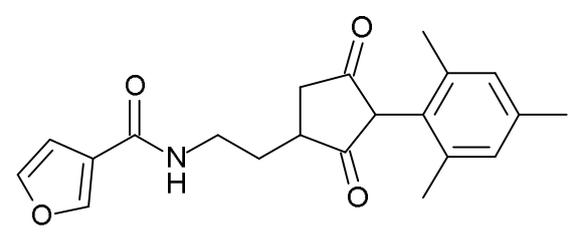
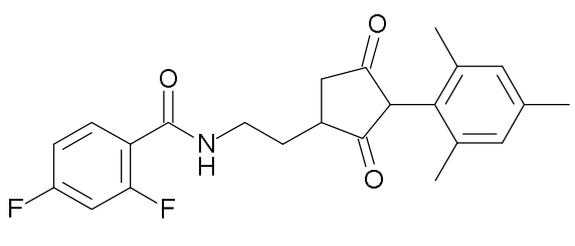
30 Número de inyecciones del compuesto = 6.

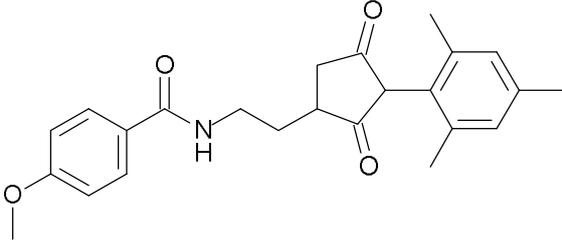
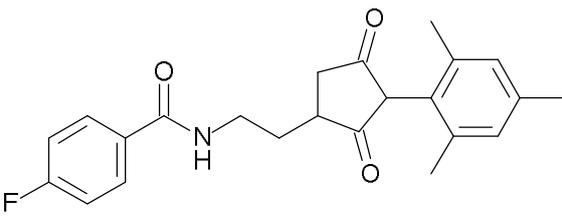
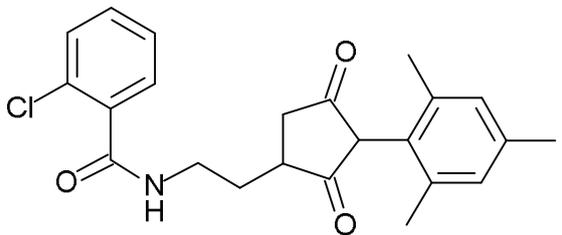
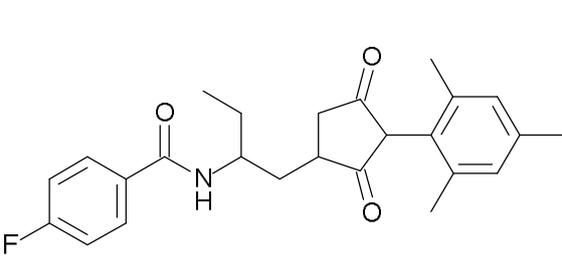
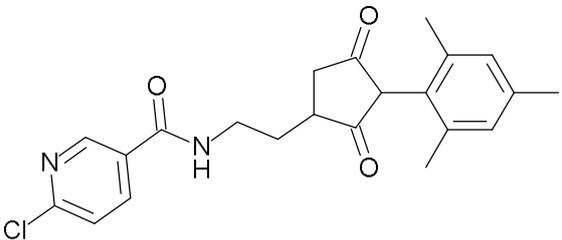
los casos en los que esto ha sucedido, los datos de caracterización se proporcionan para todos los isómeros presentes a temperatura ambiente en el disolvente especificado. A menos que se indique lo contrario, los espectros de protón de RMN se registraron a temperatura ambiente.

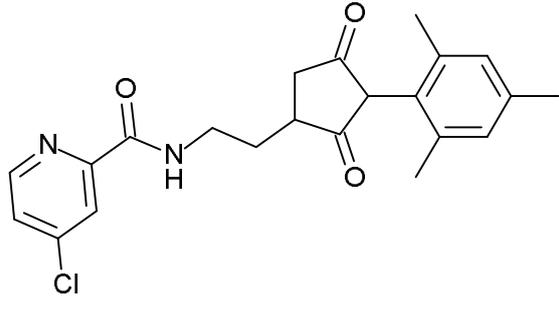
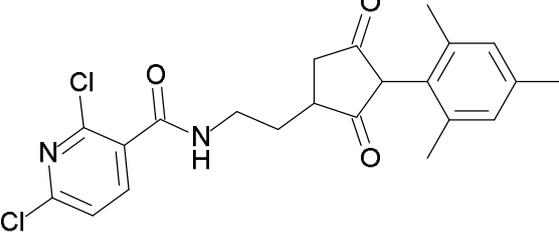
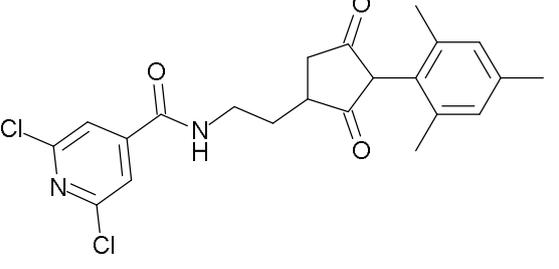
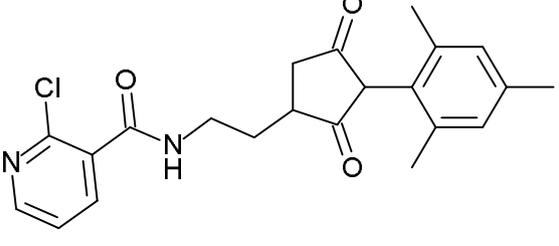
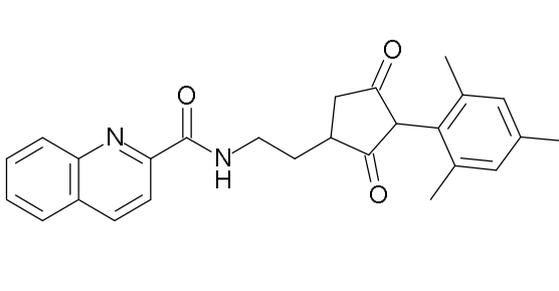
Tabla A1

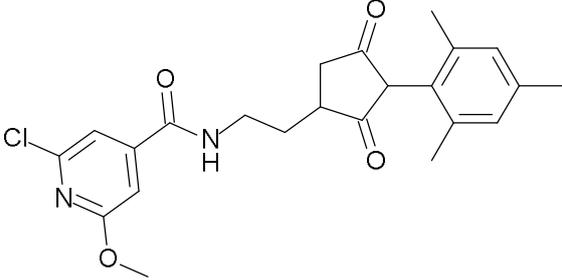
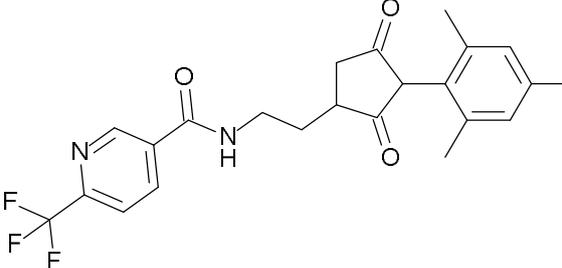
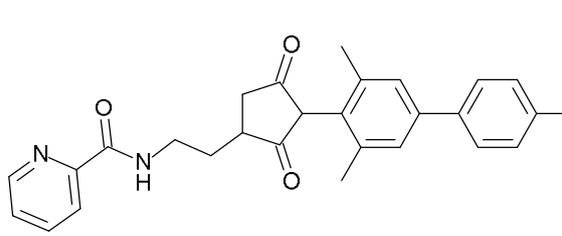
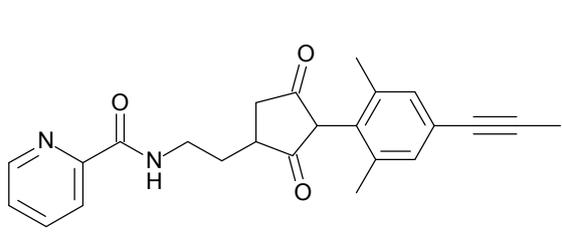
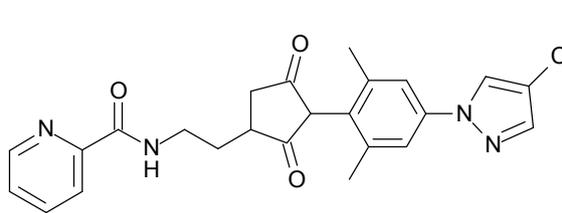
N.º de compuesto	Estructura	Datos
A1		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 7.86 - 7.80 (m, 2H), 7.56 - 7.50 (m, 1H), 7.49 - 7.42 (m, 2H), 6.86 (s, 2H), 3.55 (t, 2H), 2.95 (dd, 1H), 2.85 - 2.76 (m, 1H), 2.49 (dd, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.22 - 2.13 (m, 1H), 2.04 (s, 6H), 1.74 (tdd, 1H).
A2		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 6.85 (s, 2H), 3.35-3.30 (m, 2H), 2.90 (dd, 1H), 2.75-2.70 (m, 1H), 2.40 (d, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.05 (s, 6H), 2.05-2.00 (m, 1H), 1.65-1.55 (m, 1H), 1.20 (s, 9H)
A3		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 8.65 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.95 (dd, 1H), 7.55 (dd, 1H), 6.85 (s, 2H), 3.65-3.55 (m, 2H), 2.90 (dd, 1H), 2.80-2.75 (m, 1H), 2.50 (d, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.25-2.20 (m, 1H), 2.05 (s, 6H), 1.80-1.70 (m, 1H)
A4		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 8.05 (s, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 6.85 (s, 2H), 3.55-3.50 (m, 2H), 2.90 (dd, 1H), 2.80-2.75 (m, 1H), 2.45 (d, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.20-2.15 (m, 1H), 2.05 (s, 6H), 1.75-1.70 (m, 1H)
A5		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 7.70 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.25-7.20 (m, 1H), 6.85 (s, 2H), 3.55-3.50 (m, 2H), 2.95 (dd, 1H), 2.80-2.75 (m, 1H), 2.45 (dd, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.20-2.15 (m, 1H), 2.05 (s, 6H), 1.75-1.70 (m, 1H)

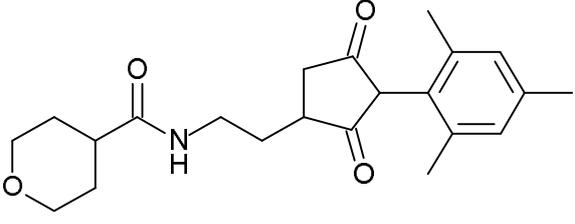
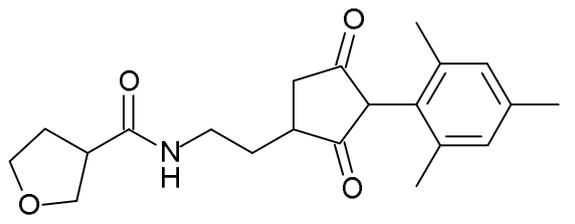
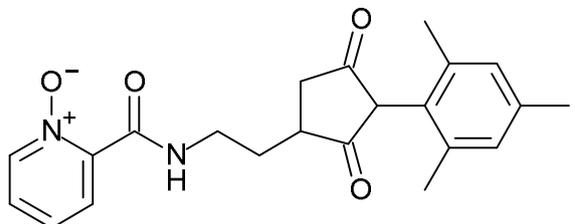
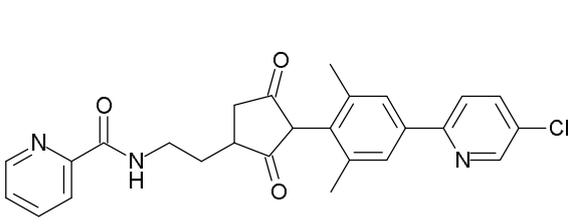
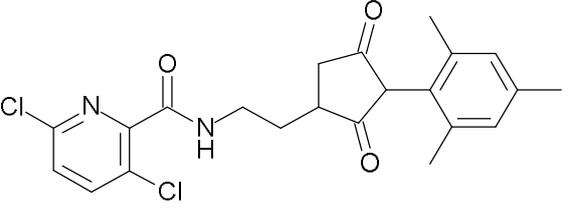
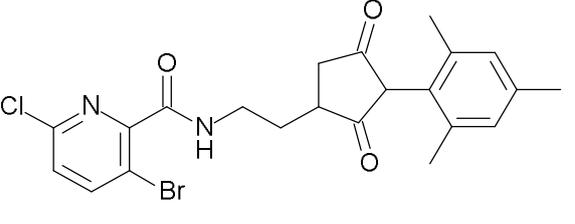
A6		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 7.55 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 6.85 (s, 2H), 3.60-3.45 (m, 2H), 2.95 (dd, 1H), 2.85-2.80 (m, 1H), 2.50 (d, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.25-2.15 (m, 1H), 2.05 (s, 6H), 1.75-1.65 (m, 1H)
A7		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.65-1.75 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.11-2.21 (1H, m), 2.23-2.26 (3H, s), 2.44-2.51 (1H, m), 2.73-2.81 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.47-3.54 (2H, m), 6.55-6.57 (1H, m), 6.84-6.87 (2H, s), 7.08-7.12 (1H, m), 7.63-7.66 (1H, m)
A8		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.56-1.68 (2H, m), 1.82-1.93 (1H, m), 1.94-2.11 (8H, m), 2.11-2.21 (1H, m), 2.22-2.34 (5H, m), 2.41-2.49 (1H, m), 2.70-2.79 (1H, m), 2.87-2.96 (1H, m), 3.07-3.17 (1H, m), 3.31-3.38 (2H, m), 6.87-6.91 (2H, s)
A9		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.54-1.65 (3H, m), 1.66-1.79 (4H, m), 1.81-1.91 (2H, m), 2.00-2.10 (7H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.39-2.46 (1H, m), 2.57-2.66 (1H, m), 2.67-2.76 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.28-3.35 (2H, m), 6.84-6.88 (2H, s)
A10		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.13-1.19 (3H, t), 1.57-1.69 (1H, m), 2.03-2.14 (7H, m), 2.20-2.30 (5H, m), 2.42-2.50 (1H, m), 2.72-2.80 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.32-3.39 (2H, m), 6.88-6.91 (2H, s)
A11		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.72-1.82 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, d), 2.11-2.22 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.46-2.53 (1H, m), 2.78-2.86 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.65 (2H, m), 3.92-3.95 (3H, s), 6.84-6.88 (2H, s), 7.01-7.07 (1H, t), 7.10-7.14 (1H, d), 7.45-7.51 (1H, m), 7.85-7.90 (1H, m)

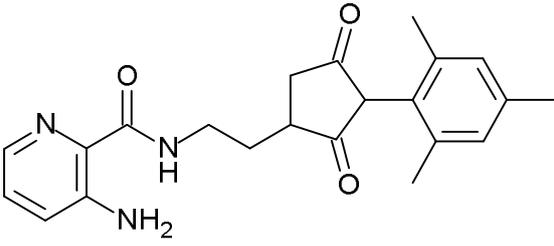
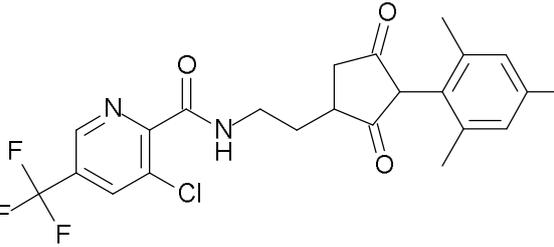
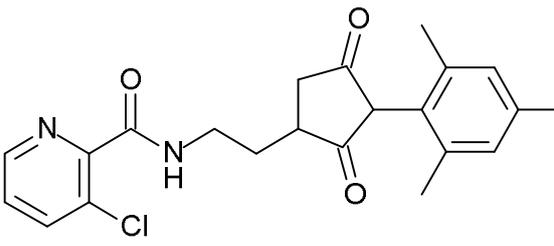
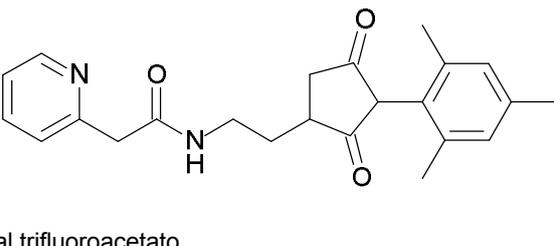
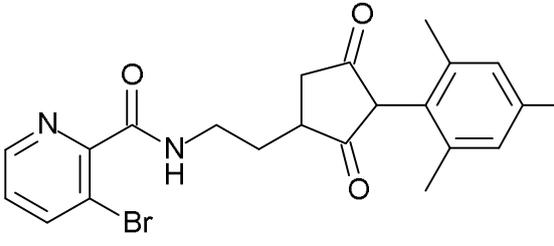
A12		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.72-1.84 (1H, m), 2.05-2.10 (6H, s), 2.17-2.30 (4H, m), 2.49-2.57 (1H, m), 2.80-2.88 (1H, m), 2.94-3.03 (1H, m), 3.57-3.63 (2H, t), 6.87-6.92 (2H, s), 7.78-7.83 (2H, d), 8.01-8.06 (2H, d)
A13		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.20-1.50 (5H, m), 1.53-1.64 (1H, m), 1.65-1.72 (1H, m), 1.75-1.83 (4H, m), 1.99-2.09 (7H, m), 2.12-2.22 (1H, m), 2.23-2.26 (3H, s), 2.37-2.44 (1H, m), 2.66-2.75 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.28-3.34 (2H, m), 6.84-6.87 (2H, s)
A14		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.03-2.06 (6H, s), 2.12-2.22 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.44-2.52 (1H, m), 2.74-2.82 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.50-3.57 (2H, t), 6.84-6.88 (2H, s), 7.30-7.37 (1H, t), 7.80-7.85 (1H, m), 7.97-8.01 (1H, m)
A15		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.69-1.80 (1H, m), 2.02-2.07 (6H, s), 2.13-2.23 (1H, m), 2.23-2.27 (3H, s), 2.46-2.53 (1H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.52-3.58 (2H, t), 6.84-6.88 (2H, s), 7.33-7.39 (2H, d), 7.91-7.97 (2H, m)
A16		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.65-1.75 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.09-2.21 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.43-2.51 (1H, m), 2.72-2.82 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.45-3.52 (2H, t), 6.78-6.81 (1H, m), 6.84-6.87 (2H, s), 7.54-7.57 (1H, m), 8.04-8.06 (1H, m)
A17		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.66-1.77 (1H, m), 2.02-2.07 (6H, s), 2.13-2.23 (1H, m), 2.23-2.26 (3H, s), 2.45-2.53 (1H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.51-3.58 (2H, m), 6.84-6.88 (2H, s), 7.03-7.11 (2H, m), 7.75-7.83 (1H, m)

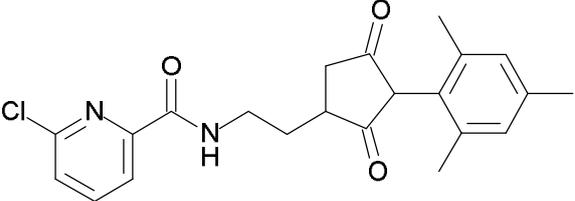
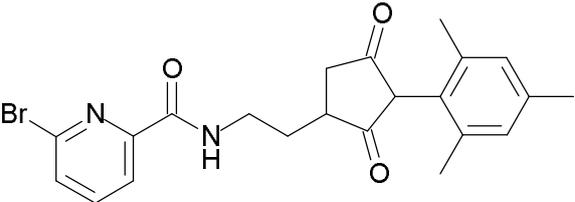
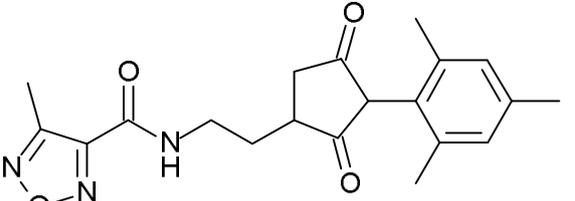
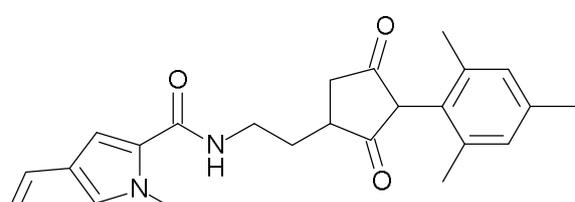
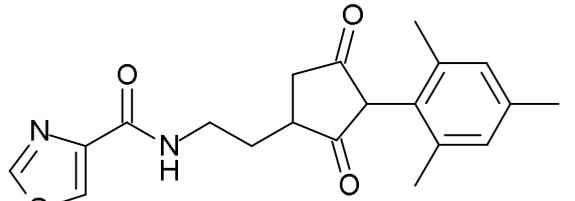
A18		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.78 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.11-2.21 (1H, m), 2.23-2.26 (3H, s), 2.44-2.51 (1H, m), 2.74-2.83 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.50-3.56 (2H, t), 3.82-3.86 (3H, s), 6.84-6.88 (2H, s), 6.95-6.70 (2H, m), 7.78-7.84 (2H, m)
A19		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.79 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.12-2.22 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.45-2.53 (1H, m), 2.75-2.84 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.50-3.57 (2H, t), 6.84-6.88 (2H, s), 7.14-7.22 (2H, m), 7.86-7.92 (2H, m)
A20		¹ H RMN (400 MHz, d-cloroformo) δ (delta) señales anchas 1.87-2.10 (8H, m), 2.21-2.27 (3H, s), 2.38-2.48 (1H, d), 2.94-3.07 (2H, m), 3.42-3.54 (1H, m), 3.71-3.83 (1H, m), 6.82-6.87 (2H, s), 7.25-7.41 (2H, m), 7.52-7.66 (2H, m)
A21		(Como una mezcla de diastereoisómeros) ¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 0.99-1.01 (3H, m), 1.17 (1H, t), 1.50-1.83 (3H, m), 2.00 (3H, s), 2.04 (3H, s), 2.11-2.20 (1H, m), 2.24 (3H, s), 2.45-2.55 (1H, m), 2.80-2.90 (1H, m), 3.55-3.65 (1H, m), 4.10-4.25 (1H, m), 6.82-6.87 (2H, m), 7.16-7.23 (2H, m), 7.88-7.95 (2H, m)
A22		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.80 (1H, m), 2.01-2.06 (6H, s), 2.13-2.22 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.45-2.53 (1H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.52-3.58 (2H, t), 6.83-6.88 (2H, s), 7.52-7.57 (1H, d), 8.17-8.23 (1H, m), 8.78-8.82 (1H, d)

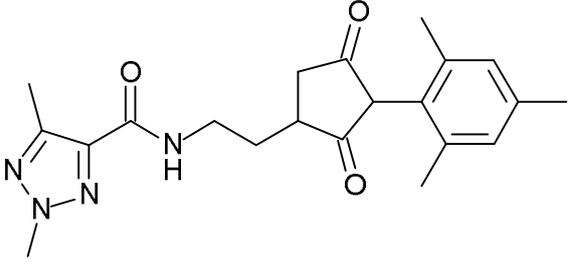
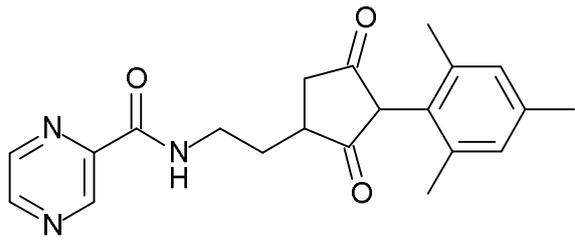
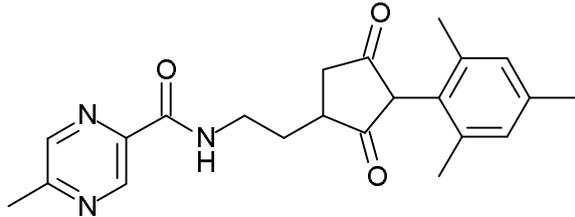
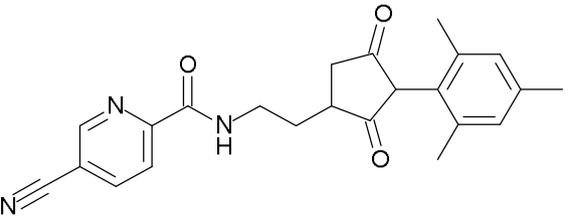
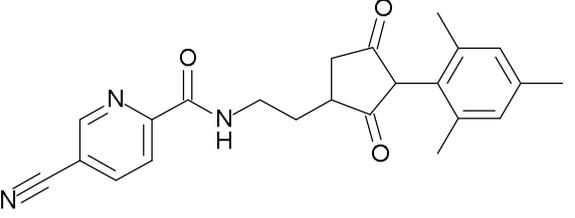
A23		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.80 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.14-2.26 (4H, m), 2.45-2.53 (1H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.55-3.62 (2H, m), 6.84-6.87 (2H, s), 7.59-7.63 (1H, m), 8.08-8.11 (1H, d), 8.55-8.59 (1H, d)
A24		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.66-1.77 (1H, m), 2.02-2.07 (6H, s), 2.14-2.27 (4H, m), 2.46-2.53 (1H, m), 2.79-2.88 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.50-3.56 (2H, m), 6.85-6.88 (2H, s), 7.48-7.52 (1H, d), 7.88-7.92 (1H, d)
A25		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, d), 2.12-2.22 (1H, m), 2.23-2.26 (3H, s), 2.44-2.51 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.51-3.56 (2H, m), 6.84-6.88 (2H, s), 7.77-7.79 (1H, s), 7.88-7.90 (1H, s)
A26		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.03-2.07 (6H, s), 2.15-2.26 (4H, m), 2.46-2.54 (1H, m), 2.79-2.90 (1H, m), 2.91-3.00 (1H, m), 3.49-3.58 (2H, m), 6.85-6.88 (2H, s), 7.43-7.47 (1H, m), 7.89-7.93 (1H, m), 8.42-8.45 (1H, m)
A27		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.75-1.86 (1H, m), 2.02-2.07 (6H, m), 2.21-2.31 (4H, m), 2.50-2.57 (1H, m), 2.82-2.90 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.62-3.70 (2H, m), 6.83-6.88 (2H, s), 7.64-7.71 (1H, t), 7.78-7.85 (1H, t), 7.96-8.01 (1H, d), 8.14-8.22 (2H, t), 8.44-8.49 (1H, d)

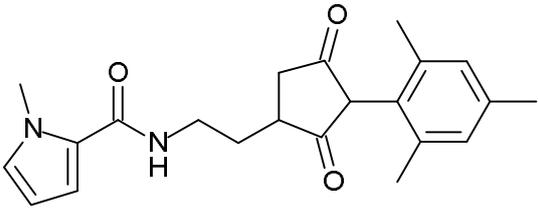
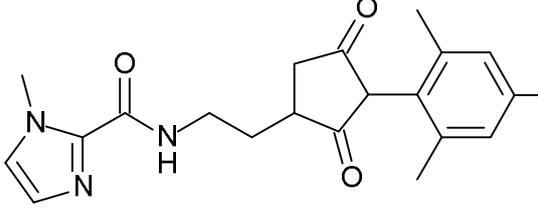
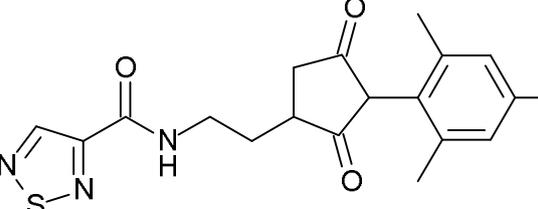
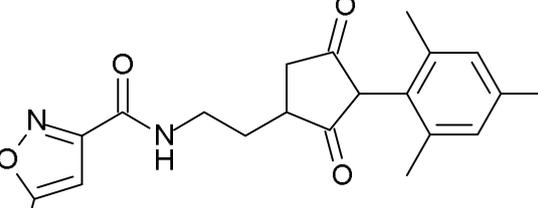
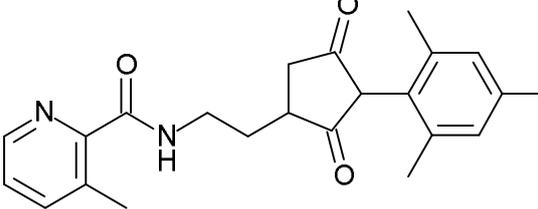
A28		¹ H NMR (400 MHz, d ₄ methanol) δ (delta) 1.66-1.77 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, m), 2.11-2.22 (1H, m), 2.22-2.27 (3H, s), 2.43-2.52 (1H, m), 2.73-2.83 (1H, m), 2.88-2.98 (1H, m), 3.49-3.55 (2H, m), 3.99 (3H, s), 6.86 (2H, s), 7.10 (1H, d), 7.33 (1H, d)
A29		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.65-1.78 (1H, m), 2.02-2.07 (6H, m), 2.11-2.22 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.43-2.52 (1H, m), 2.72-2.83 (1H, m), 2.88-2.98 (1H, m), 3.49-3.55 (2H, t), 6.84-6.88 (2H, s), 7.08-7.11 (1H, s), 7.32-7.35 (1H, s), 7.88-7.90 (1H, s)
A32		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.75-1.89 (1H, m), 2.13-2.18 (6H, s), 2.20-2.32 (1H, m), 2.50-2.60 (1H, m), 2.83-2.93 (1H, m), 2.97-3.09 (1H, m), 3.64-3.70 (2H, t), 7.08-7.16 (2H, t), 7.22-7.26 (2H, s), 7.53-7.60 (2H, m), 8.11-8.18 (1H, t), 8.54-8.61 (1H, m), 8.63-8.71 (1H, t), 8.84-8.90 (1H, d a)
A33		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.69-1.82 (1H, m), 1.96-2.00 (3H, s), 2.01-2.09 (6H, s), 2.13-2.25 (1H, m), 2.46-2.55 (1H, m), 2.76-2.85 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.56-3.63 (2H, m), 7.02-7.07 (2H, s), 7.50-7.57 (1H, m), 7.91-7.98 (1H, t), 8.05-8.13 (1H, m), 8.59-8.66 (1H, m)
A34		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.85-1.95 (1H, m), 2.18-2.21 (6H, s), 2.21-2.29 (3H, m), 2.87-3.05 (2H, m), 3.40-3.52 (1H, m), 7.34-7.38 (2H, m), 7.51-7.58 (1H, m), 7.61-7.64 (1H, s), 7.87-7.90 (1H, s), 7.90-7.97 (1H, t), 8.21-8.26 (1H, d), 8.61-8.65 (1H, d), 8.70-8.77 (1H, m)

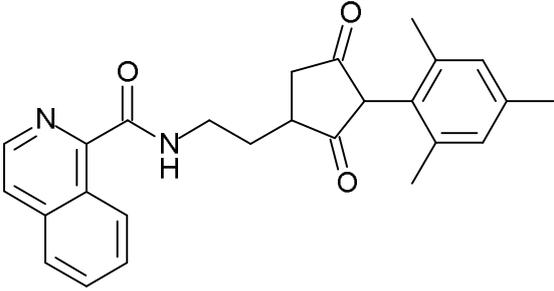
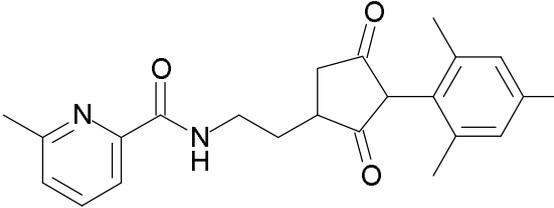
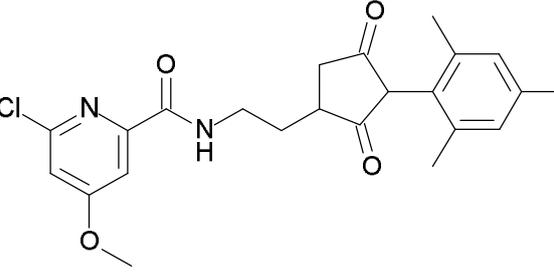
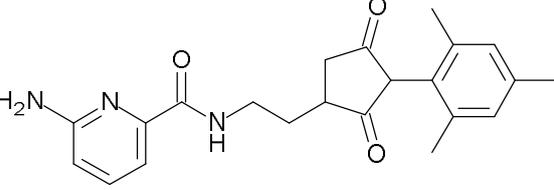
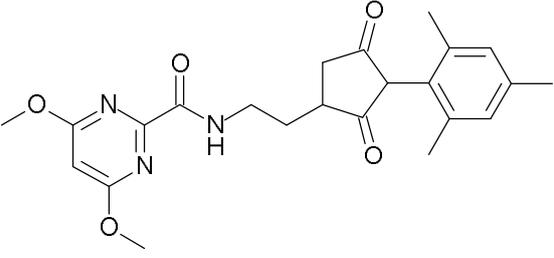
A35		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.61-1.87 (5H, m), 2.04-2.13 (6H, m), 2.25-2.30 (3H, m), 2.49-2.88 (3H, m), 2.96-3.05 (1H, m), 3.14-3.23 (1H, m), 3.35-3.51 (4H, m), 3.89-4.01 (2H, m), 6.86-6.93 (2H, m)
A36		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.59-1.72 (1H, m), 2.02-2.20 (8H, m), 2.25-2.30 (3H, s), 2.47-2.54 (1H, m), 2.65-2.76 (1H, m), 2.77-2.86 (1H, m), 2.94-3.22 (2H, m), 3.35-3.42 (2H, m), 3.74-4.00 (4H, m), 6.86-6.93 (2H, m)
A37		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.74-1.86 (1H, m), 2.10-2.20 (6H, s), 2.21-2.32 (4H, m), 2.46-2.57 (1H, m), 2.82-2.88 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.62-3.72 (2H, t), 6.85-6.88 (2H, s), 7.58-7.70 (2H, m), 8.33-8.42 (2H, m)
A38		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.73-1.85 (1H, m), 2.16-2.28 (7H, m), 2.50-2.59 (1H, m), 2.81-2.89 (1H, m), 2.93-3.03 (1H, m), 3.56-3.66 (2H, m), 7.48-7.62 (1H, s a), 7.64-7.68 (2H, s), 7.81-7.89 (2H, m), 7.93-7.99 (1H, t), 8.01-8.18 (1H, s a), 8.54-8.58 (1H, s), 8.58-8.71 (1H, s a)
A39	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.65-1.77 (1H, m), 2.01-2.07 (6H, s), 2.14-2.26 (4H, m), 2.45-2.54 (1H, m), 2.77-2.86 (1H, m), 2.89-2.99 (1H, m), 3.44-3.62 (2H, m), 6.81-6.88 (2H, s), 7.48-7.54 (1H, d), 7.88-7.94 (1H, d)
A40	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.66-1.77 (1H, m), 2.03-2.07 (6H, s), 2.16-2.26 (4H, m), 2.47-2.54 (1H, m), 2.81-2.88 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.47-3.63 (2H, m), 6.84-6.88 (2H, s), 7.43-7.47 (1H, d), 8.08-8.12 (1H, d)

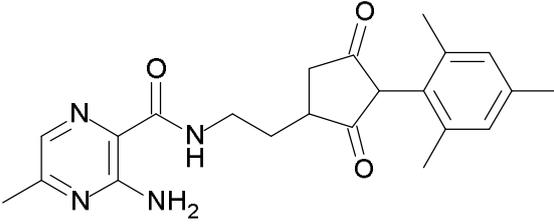
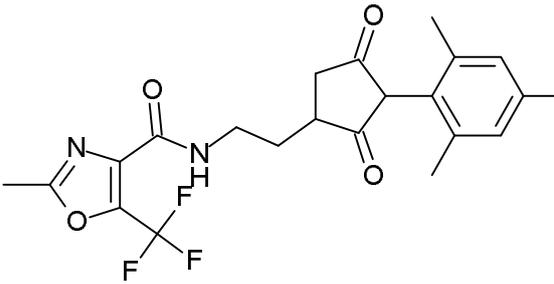
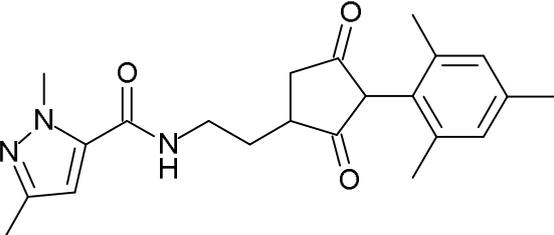
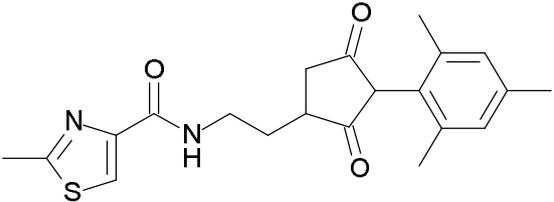
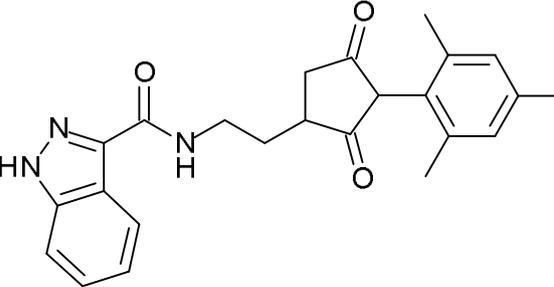
A41	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.79 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.12-2.22 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.45-2.52 (1H, m), 2.78-2.85 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.51-3.57 (2H, t), 6.84-6.87 (2H, s), 7.18-7.26 (2H, m), 7.84-7.86 (1H, m)
A43	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.71-1.82 (1H, m), 2.05-2.12 (6H, s), 2.20-2.31 (4H, m), 2.51-2.59 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 2.94-3.03 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 6.87-6.92 (2H, s), 8.38-8.41 (1H, s), 8.86-8.90 (1H, s)
A44	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.03-2.07 (6H, s), 2.16-2.27 (4H, m), 2.47-2.55 (1H, m), 2.81-2.90 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.49-3.64 (2H, m), 6.84-6.88 (2H, s), 7.47-7.52 (1H, m), 7.94-7.98 (1H, m), 8.50-8.54 (1H, m)
A45	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.59-1.71 (1H, m), 2.01-2.16 (7H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.39-2.47 (1H, m), 2.73-2.80 (1H, m), 2.86-2.95 (1H, m), 3.36-3.43 (2H, m), 4.87-4.94 (2H, s), 6.84-6.88 (2H, s), 7.94-7.99 (2H, m), 8.51-8.57 (1H, m), 8.72-8.77 (1H, m)
A46	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.71-1.81 (1H, m), 2.06-2.10 (6H, s), 2.20-2.31 (4H, m), 2.51-2.58 (1H, m), 2.86-2.93 (1H, m), 2.96-3.03 (1H, m), 3.52-3.67 (2H, m), 6.88-6.91 (2H, s), 7.41-7.46 (1H, m), 8.14-8.18 (1H, m), 8.56-8.59 (1H, m)

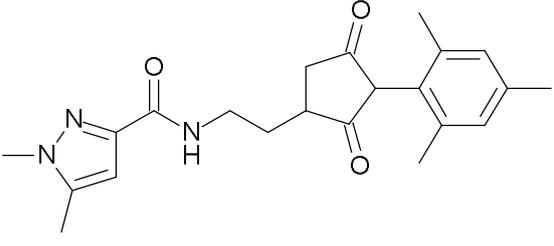
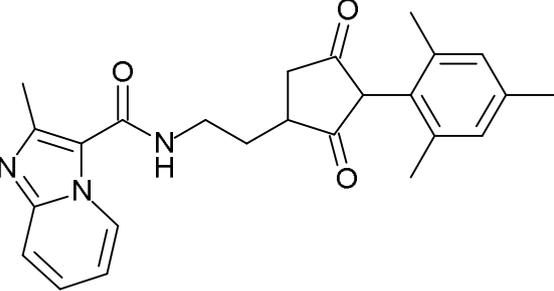
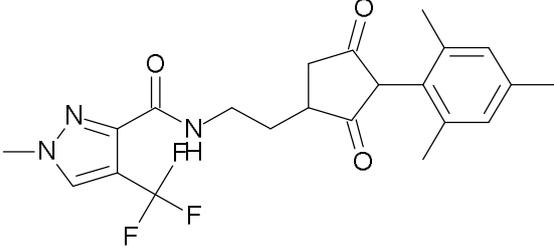
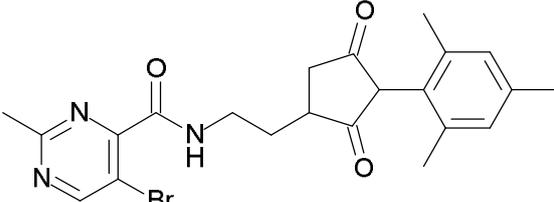
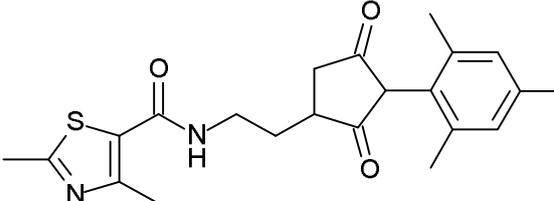
A47	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.15-2.27 (4H, m), 2.45-2.52 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.64 (2H, m), 6.83-6.87 (2H, s), 7.58-7.62 (1H, m), 7.93-7.99 (1H, t), 8.03-8.07 (1H, d)
A48	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.14-2.26 (4H, m), 2.45-2.52 (1H, m), 2.76-2.83 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.64 (2H, m), 6.83-6.87 (2H, s), 7.72-7.77 (1H, d), 7.82-7.88 (1H, t), 8.06-8.09 (1H, d)
A50		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.57-1.68 (1H, m), 2.01-2.05 (6H, d), 2.06-2.17 (1H, m), 2.22-2.26 (3H, s), 2.38-2.46 (1H, m), 2.63-2.74 (1H, m), 2.80-2.91 (1H, m), 3.35-3.50 (2H, m), 5.70-5.85 (1H, m), 6.84-6.88 (2H, s), 7.37-7.50 (5H, m)
A51		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.76 (1H, m), 2.02-2.08 (6H, s), 2.15-2.26 (4H, m), 2.45-2.51 (1H, m), 2.52-2.56 (3H, s), 2.76-2.83 (1H, m), 2.90-2.97 (1H, m), 3.50-3.58 (2H, m), 6.84-6.88 (2H, s)
A52		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.79 (1H, m), 2.03-2.06 (6H, s), 2.14-2.25 (4H, m), 2.47-2.54 (1H, m), 2.77-2.85 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.49-3.56 (2H, t), 3.97-3.99 (3H, s), 6.84-6.87 (2H, s), 7.00-7.02 (1H, s), 7.06-7.11 (1H, t), 7.24-7.30 (1H, t), 7.39-7.44 (1H, t), 7.57-7.61 (1H, d)
A53		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.79 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.13-2.25 (4H, m), 2.45-2.52 (1H, m), 2.76-2.83 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.52-3.61 (2H, m), 6.83-6.87 (2H, s), 8.22-8.24 (1H, m), 8.97-8.98 (1H, m)

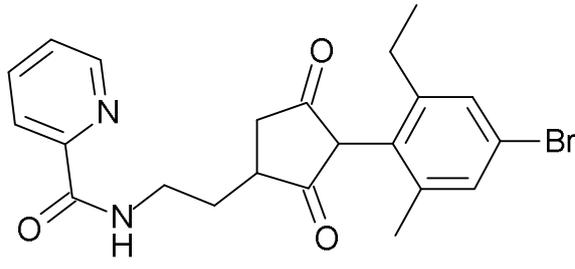
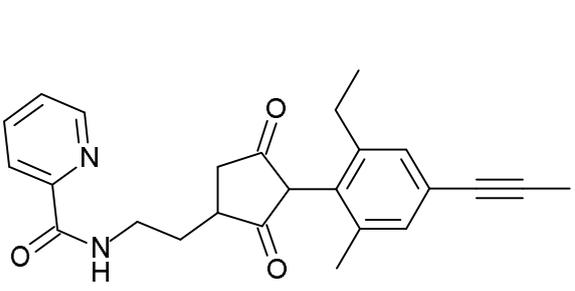
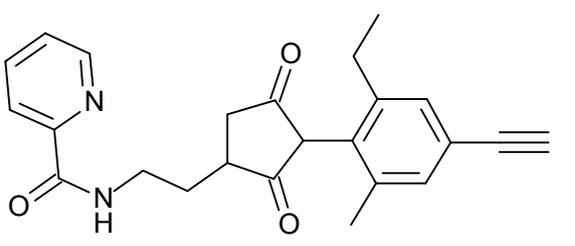
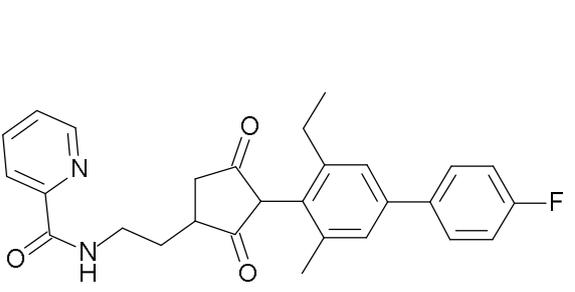
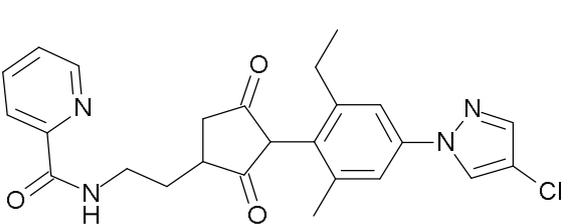
A54		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.64-1.75 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.10-2.21 (1H, m), 2.22-2.25 (3H, s), 2.44-2.50 (4H, m), 2.75-2.82 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.47-3.52 (2H, t), 4.10-4.12 (3H, s), 6.84-6.87 (2H, s)
A55	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.69-1.81 (1H, m), 2.02-2.06 (6H, s), 2.15-2.26 (4H, m), 2.46-2.53 (1H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.53-3.67 (2H, m), 6.82-6.86 (2H, s), 8.64-8.67 (1H, m), 8.74-8.76 (1H, m), 9.21-9.23 (1H, m)
A56	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.68-1.79 (1H, m), 2.01-2.05 (6H, s), 2.14-2.26 (4H, m), 2.46-2.53 (1H, m), 2.61-2.64 (3H, s), 2.76-2.83 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.52-3.66 (2H, m), 6.83-6.88 (2H, s), 8.56-8.58 (1H, s), 9.06-9.09 (1H, s)
A57		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.69-1.80 (1H, m), 2.02-2.05 (6H, s), 2.15-2.25 (4H, m), 2.46-2.52 (1H, m), 2.76-2.83 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.53-3.66 (2H, m), 6.83-6.86 (2H, s), 8.19-8.24 (1H, d), 8.30-8.34 (1H, m), 8.93-8.95 (1H, m)
A57A	 <p>sal trifluoroacetato</p>	

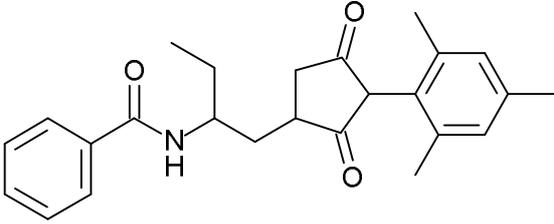
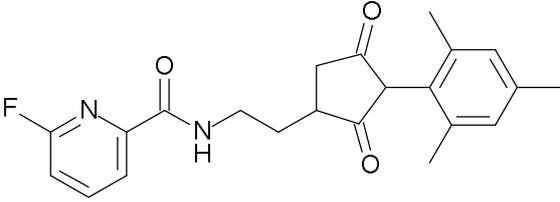
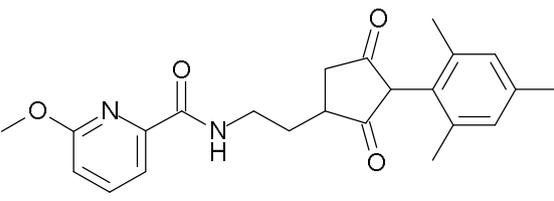
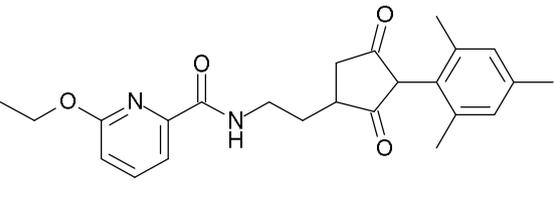
A58		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.06-2.09 (6H, s), 2.10-2.21 (1H, m), 2.26-2.29 (3H, s), 2.46-2.53 (1H, m), 2.78-2.85 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.44-3.52 (2H, m), 3.90-3.92 (3H, s), 6.06-6.09 (1H, m), 6.76-6.79 (1H, m), 6.81-6.84 (1H, m), 6.88-6.91 (2H, s)
A59	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.69-1.79 (1H, m), 2.00-2.03 (6H, s), 2.16-2.25 (1H, m), 2.26-2.29 (3H, s), 2.47-2.54 (1H, m), 2.81-2.88 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.52-3.58 (2H, t), 4.03-4.05 (3H, s), 6.87-6.91 (2H, s), 7.06-7.09 (1H, s), 7.26-7.29 (1H, s)
A60		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.74-1.88 (1H, m), 2.04-2.10 (6H, s), 2.22-2.32 (4H, m), 2.50-2.57 (1H, m), 2.82-2.90 (1H, m), 2.93-3.02 (1H, m), 3.59-3.72 (2H, m), 6.85-6.89 (2H, s), 9.44-9.47 (1H, s)
A61		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.60-1.71 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, s), 2.08-2.18 (1H, m), 2.18-2.21 (3H, s), 2.37-2.48 (4H, m), 2.69-2.77 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.41-3.54 (2H, m), 6.38-6.41 (1H, s), 6.80-6.83 (2H, s)
A62	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.64-1.75 (1H, m), 1.99-2.03 (6H, s), 2.11-2.21 (4H, m), 2.42-2.49 (1H, m), 2.53-2.56 (3H, s), 2.75-2.82 (1H, m), 2.85-2.94 (1H, m), 3.48-3.54 (2H, t), 6.80-6.83 (2H, s), 7.36-7.41 (1H, m), 7.68-7.73 (1H, d), 8.35-8.39 (1H, d)

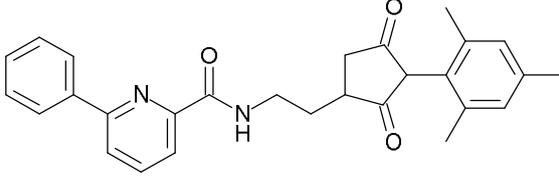
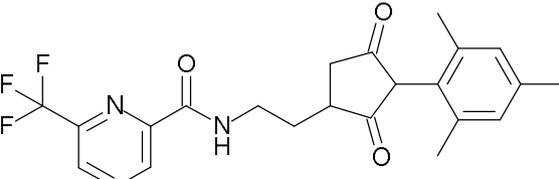
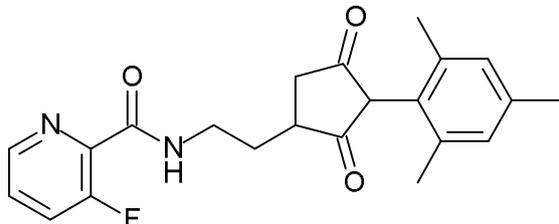
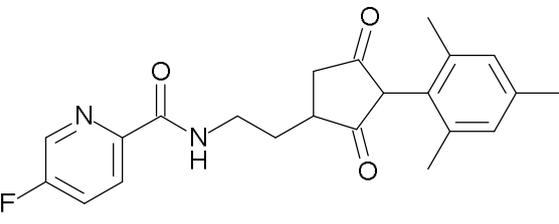
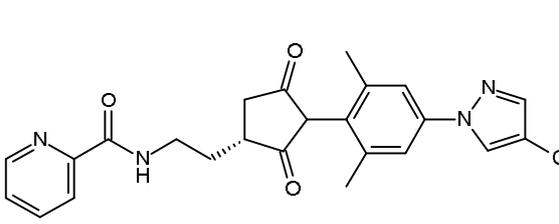
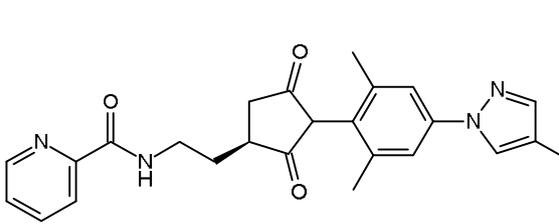
A63	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 1.76-1.88 (1H, m), 2.05-2.11 (6H, s), 2.22-2.35 (4H, m), 2.52-2.60 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 2.96-3.03 (1H, m), 3.63-3.69 (2H, t), 6.84-6.88 (2H, s), 7.67-7.73 (1H, t), 7.75-7.81 (1H, t), 7.89-7.93 (1H, d), 7.93-7.97 (1H, d), 8.45-8.49 (1H, d), 8.93-8.98 (1H, d)
A64	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.65-1.76 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, s), 2.10-2.21 (4H, m), 2.42-2.49 (1H, m), 2.53-2.56 (3H, s), 2.72-2.80 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.48-3.60 (2H, m), 6.79-6.82 (2H, s), 7.36-7.40 (1H, d), 7.77-7.82 (1H, t), 7.84-7.88 (1H, d)
A65	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.64-1.76 (1H, m), 2.02-2.07 (6H, s), 2.13-2.25 (4H, m), 2.38-2.46 (1H, m), 2.69-2.77 (1H, m), 2.82-2.90 (1H, m), 3.48-3.62 (2H, m), 3.91-3.96 (3H, s), 6.81-6.85 (2H, s), 7.12-7.15 (1H, s), 7.57-7.60 (1H, s)
A66	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.70-1.81 (1H, m), 2.06-2.11 (6H, s), 2.14-2.28 (4H, m), 2.36-2.44 (1H, m), 2.70-2.77 (1H, m), 2.80-2.89 (1H, m), 3.54-3.60 (2H, t), 6.68-6.73 (1H, d), 6.84-6.88 (2H, s), 7.30-7.34 (1H, d), 7.53-7.59 (1H, t)
A69	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.64-1.75 (1H, m), 2.00-2.07 (6H, d), 2.08-2.19 (4H, m), 2.20-2.27 (1H, m), 2.53-2.61 (1H, m), 2.63-2.71 (1H, m), 3.47-3.61 (2H, m), 3.94-4.00 (6H, s), 6.18-6.21 (1H, s), 6.73-6.78 (2H, d)

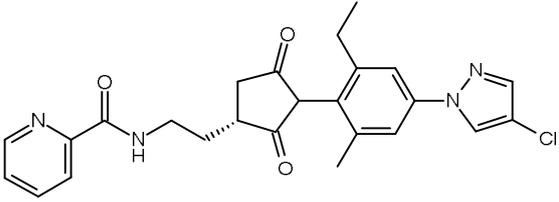
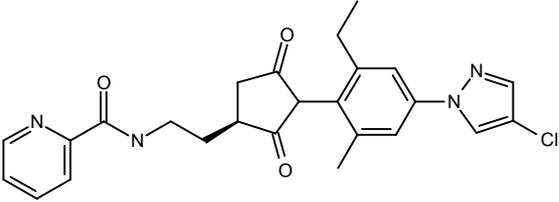
A70	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.61-1.72 (1H, m), 1.97-2.01 (6H, s), 2.07-2.20 (4H, m), 2.29-2.34 (3H, s), 2.40-2.47 (1H, m), 2.71-2.78 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.44-3.50 (2H, t), 6.78-6.81 (2H, s), 7.67-7.69 (1H, s)
A71	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.67-1.78 (1H, m), 2.05-2.09 (6H, s), 2.12-2.24 (1H, m), 2.26-2.29 (3H, s), 2.47-2.54 (1H, m), 2.55-2.58 (3H, s), 2.76-2.84 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.49-3.58 (2H, m), 6.87-6.91 (2H, s)
A72	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.60-1.71 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, d), 2.03-2.15 (1H, m), 2.15-2.18 (3H, s), 2.18-2.21 (3H, s), 2.39-2.46 (1H, m), 2.69-2.77 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.39-3.45 (2H, t), 3.97-3.99 (3H, s), 6.47-6.50 (1H, s), 6.79-6.83 (2H, s)
A73	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.62-1.73 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, s), 2.08-2.18 (1H, m), 2.18-2.21 (3H, s), 2.40-2.47 (1H, m), 2.64-2.67 (3H, s), 2.71-2.78 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.46-3.53 (2H, m), 6.79-6.82 (2H, s), 7.95-7.97 (1H, s)
A74	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 1.64-1.75 (1H, m), 1.98-2.01 (6H, s), 2.12-2.22 (4H, m), 2.42-2.49 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.52-3.58 (2H, t), 6.76-6.79 (2H, s), 7.16-7.21 (1H, t), 7.31-7.37 (1H, t), 7.47-7.52 (1H, d), 8.16-8.21 (1H, d)

A75	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.59-1.70 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, s), 2.03-2.17 (1H, m), 2.17-2.21 (3H, s), 2.21-2.24 (3H, s), 2.38-2.45 (1H, m), 2.69-2.77 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.42-3.48 (2H, t), 3.72-3.75 (3H, s), 6.42-6.44 (1H, s), 6.79-6.82 (2H, s)
A76	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 1.75-1.86 (1H, m), 2.07-2.10 (6H, s), 2.20-2.30 (4H, m), 2.41-2.46 (1H, m), 2.64-2.67 (3H, s), 2.75-2.83 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.59-3.63 (2H, t), 6.81-6.85 (2H, s), 7.01-7.07 (1H, t), 7.42-7.48 (1H, t), 7.51-7.56 (1H, d), 9.02-9.07 (1H, d)
A77	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.60-1.71 (1H, m), 1.99-2.02 (6H, s), 2.07-2.17 (1H, m), 2.17-2.20 (3H, s), 2.40-2.47 (1H, m), 2.70-2.78 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.43-3.49 (2H, t), 3.86-3.88 (3H, s), 6.79-6.82 (2H, s), 7.99-8.02 (1H, s)
A78	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.63-1.74 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, s), 2.11-2.22 (4H, m), 2.43-2.50 (1H, m), 2.61-2.64 (3H, s), 2.76-2.83 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.43-3.59 (2H, m), 6.80-6.84 (2H, s), 8.84-8.86 (1H, s)
A79	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.61-1.72 (1H, m), 1.98-2.02 (6H, s), 2.05-2.15 (1H, m), 2.19-2.22 (3H, s), 2.40-2.47 (1H, m), 2.52-2.55 (3H, s), 2.62-2.64 (3H, s), 2.69-2.77 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.41-3.46 (2H, t), 6.80-6.83 (2H, s)

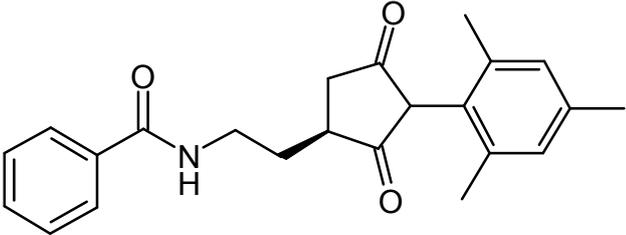
A83		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 8.63 (d, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.97-7.93 (m, 1H), 7.56-7.52 (m, 1H), 7.22 (s, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 2.97-2.93 (m, 1H), 2.81 (a, 1H), 2.51 (d, 1H), 2.39 (c, 2H), 2.26-2.14 (m, 1H), 2.06 (2, 3H), 1.81-1.68 (m, 1H), 1.07-1.03 (m, 3H)
A84		(Como una mezcla de atropisómeros) ¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.12 (dt, 3H), 1.78 - 1.94 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.11 (s, 1.5H), 2.15 (s, 1.5H), 2.18 (d, 1H), 2.44 (dt, 2H), 2.81 - 3.04 (m, 2H), 3.35 - 3.53 (m, 1H), 4.04 - 4.25 (m, 1H), 7.05 - 7.19 (m, 2H), 7.46 - 7.60 (m, 1H), 7.91 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.69 (s a, 1H), 12.25 (s a, 1H)
A85		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.05 - 1.18 (m, 3H), 1.87 (t, 1H), 2.10 - 2.23 (m, 4H), 2.40 - 2.56 (m, 2H), 2.83 - 3.00 (m, 2H), 3.01 (s, 1H), 3.43 (d, 1H), 4.08 - 4.21 (m, 1H), 7.20 - 7.26 (m, 2H), 7.42 - 7.50 (m, 1H), 7.92 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.71 (s a, 1H)
A86		(Como una mezcla de atropisómeros) ¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 12.35 (a, 1H), 8.71 (a, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.96-7.88 (m, 1H), 7.57-7.49 (m, 3H), 7.26 (s, 2H), 7.10 (t, 2H), 4.18 (d, 1H), 3.44 (d, 1H), 3.04-2.96 (m, 1H), 2.96-2.88 (m, 1H), 2.58-2.54 (m, 2H), 2.26 (s, 1.5H), 2.22 (s, 1.5H), 2.26-2.17 (m, 2H), 1.89 (t, 1H), 1.20-1.16 (m, 3H)
A87		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 8.71 (a, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.01-7.84 (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.57-7.49 (m, 1H), 7.46-7.32 (m, 2H), 4.25-4.11 (m, 1H), 3.46 (a, 1H), 3.05-2.83 (m, 2H), 2.56-2.52 (m, 2H), 2.25-2.20 (m, 5H), 1.88 (a, 1H), 1.23-1.11 (m, 3H)

A88		(Como una mezcla de diastereoisómeros) ¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 0.96-1.03 (3H, m), 1.14-1.20 (1H, t), 1.55-1.82 (3H, m), 2.00-2.03 (3H, s), 2.03-2.06 (3H, s), 2.12-2.21 (1H, m), 2.22-2.25 (3H, s), 2.46-2.55 (1H, m), 2.82-2.92 (1H, m), 3.56-3.63 (1H, c), 4.13-4.23 (1H, m), 6.83-6.87 (2H, d), 7.43-7.49 (2H, m), 7.50-7.56 (1H, m), 7.83-7.88 (2H, m)
A89		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.70-1.81 (1H, m), 2.05-2.09 (6H, s), 2.17-2.28 (4H, m), 2.48-2.55 (1H, m), 2.78-2.86 (1H, m), 2.91-3.00 (1H, m), 3.53-3.68 (2H, m), 6.86-6.90 (2H, s), 7.24-7.29 (1H, m), 8.01-8.05 (1H, m), 8.08-8.16 (1H, m)
A89A	 <p>sal trifluoroacetato</p>	
A91	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.70-1.81 (1H, m), 1.97-2.02 (6H, d), 2.08-2.18 (1H, m), 2.18-2.22 (3H, s), 2.42-2.49 (1H, m), 2.72-2.80 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.49-3.63 (2H, m), 3.91-3.94 (3H, s), 6.79-6.83 (2H, d), 6.88-6.92 (1H, d), 7.61-7.65 (1H, d), 7.72-7.78 (1H, t)
A92	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.35-1.42 (3H, t), 1.78-1.89 (1H, m), 2.04-2.09 (6H, d), 2.13-2.24 (1H, m), 2.25-2.29 (3H, s), 2.49-2.56 (1H, m), 2.79-2.87 (1H, m), 2.93-3.01 (1H, m), 3.56-3.69 (2H, m), 4.39-4.50 (3H, m), 6.86-6.90 (2H, d), 6.92-6.97 (1H, d), 7.66-7.71 (1H, d), 7.78-7.85 (1H, t)

A93	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.75-1.86 (1H, m), 2.01-2.06 (6H, s), 2.13-2.25 (4H, m), 2.47-2.54 (1H, m), 2.77-2.86 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.57-3.70 (2H, m), 6.80-6.86 (2H, d), 7.38-7.51 (3H, m), 7.94-8.18 (5H, m)
A94	 <p>sal trifluoroacetato</p>	¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.69-1.80 (1H, m), 2.01-2.06 (6H, s), 2.16-2.26 (4H, m), 2.46-2.53 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 6.82-6.86 (2H, s), 7.94-7.99 (1H, d), 8.18-8.24 (1H, t), 8.32-8.36 (1H, d)
A96		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.70-1.82 (1H, m), 2.05-2.09 (6H, s), 2.17-2.28 (4H, m), 2.49-2.56 (1H, m), 2.80-2.88 (1H, m), 2.92-3.01 (1H, m), 3.53-3.68 (2H, m), 6.86-6.90 (2H, s), 7.59-7.65 (1H, m), 7.70-7.78 (1H, t), 8.45-8.50 (1H, d)
A97		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.71-1.82 (1H, m), 2.05-2.08 (6H, s), 2.16-2.28 (4H, m), 2.47-2.55 (1H, m), 2.78-2.86 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.56-3.65 (2H, m), 6.86-6.89 (2H, s), 7.71-7.79 (1H, m), 8.15-8.21 (1H, m), 8.52-8.55 (1H, d)
A98		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.73-1.84 (1H, m), 2.12-2.27 (7H, m), 2.51-2.58 (1H, m), 2.81-2.89 (1H, m), 2.94-3.02 (1H, m), 3.57-3.67 (2H, m), 7.42-7.45 (2H, s), 7.55-7.61 (1H, t), 7.64-7.66 (1H, s), 7.97-8.03 (1H, t), 8.10-8.15 (1H, d), 8.31-8.34 (1H, s), 8.63-8.67 (1H, d)
A99		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.73-1.84 (1H, m), 2.12-2.27 (7H, m), 2.51-2.58 (1H, m), 2.81-2.89 (1H, m), 2.94-3.02 (1H, m), 3.57-3.67 (2H, m), 7.42-7.45 (2H, s), 7.55-7.61 (1H, t), 7.64-7.66 (1H, s), 7.97-8.03 (1H, t), 8.10-8.15 (1H, d), 8.31-8.34 (1H, s), 8.63-8.67 (1H, d)

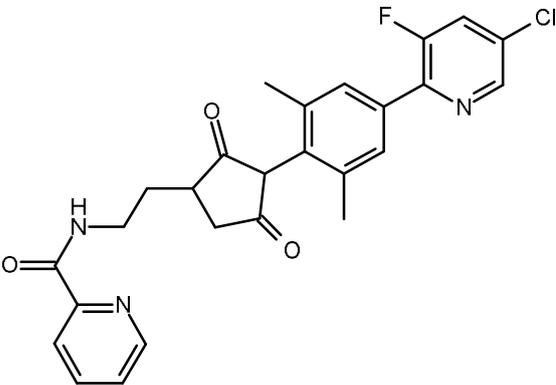
A100		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 8.71 (a, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.01-7.84 (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.57-7.49 (m, 1H), 7.46-7.32 (m, 2H), 4.25-4.11 (m, 1H), 3.46 (a, 1H), 3.05-2.83 (m, 2H), 2.56-2.52 (m, 2H), 2.25-2.20 (m, 5H), 1.88 (a, 1H), 1.23-1.11 (m, 3H)
A101		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 8.71 (a, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.01-7.84 (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.57-7.49 (m, 1H), 7.46-7.32 (m, 2H), 4.25-4.11 (m, 1H), 3.46 (a, 1H), 3.05-2.83 (m, 2H), 2.56-2.52 (m, 2H), 2.25-2.20 (m, 5H), 1.88 (a, 1H), 1.23-1.11 (m, 3H)

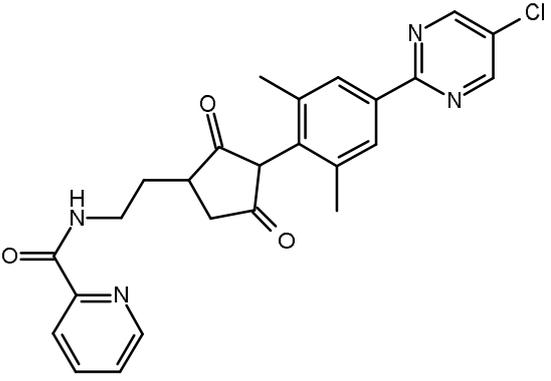
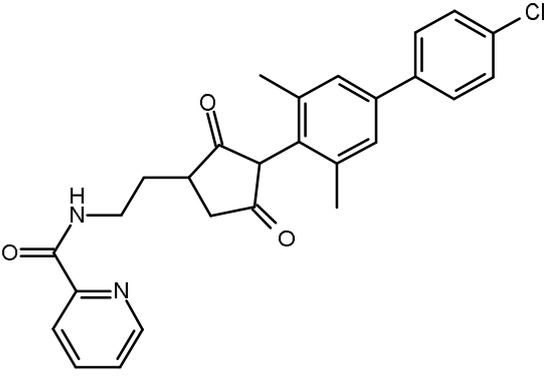
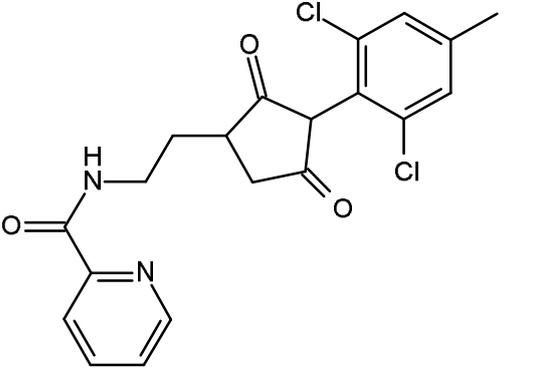
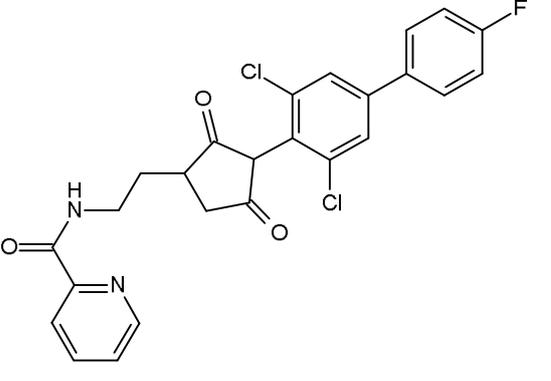
El siguiente compuesto también es una realización de la presente invención:

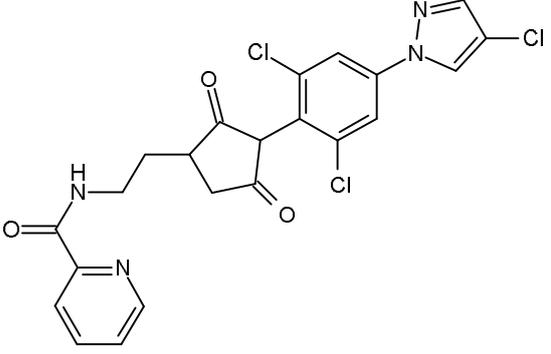
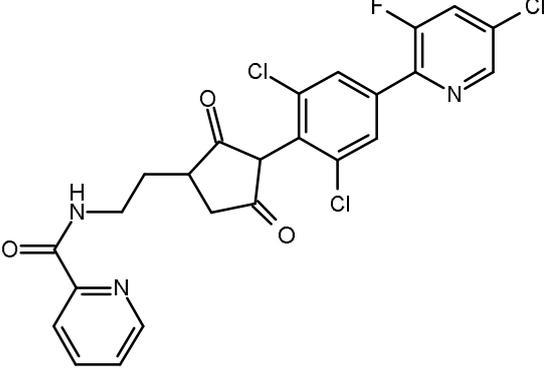
A1A		
-----	--	--

- 5 Los compuestos adicionales de la **Tabla A2** siguiente ilustran la presente invención y son realizaciones particulares de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención. En su mayor parte (en particular para los compuestos en los que R¹ = R³ = metilo, p. ej., los compuestos A102, A103 y A104), se cree que estos compuestos se pueden preparar, por ejemplo, mediante métodos similares a los que se muestran en los Ejemplos y/o en la sección de los procesos anterior de la presente utilizando materiales de partida adecuados y con cualesquiera cambios adecuados y/o necesarios en los procesos.

10 **Tabla A2**

Número de compuesto	Estructura	Datos
A102		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.99 (s, 3H), 2.08-2.42 (m, 7H), 2.91 (s a, 1H), 3.50 (s a, 1H), 3.89 (s a, 1H), 7.39-7.51 (m, 2H), 7.57 (s a, 2H), 7.85 (t, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.55 (d, 2H)

A103		
A104		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.84 - 1.95 (m, 1H), 2.15 - 2.25 (m, 5H), 2.28 (s, 3H), 2.85 - 2.96 (m, 1H), 2.96 - 3.06 (m, 1H), 3.37 - 3.48 (m, 1H), 4.15 - 4.26 (m, 1H), 7.24-7.28 (m, 2H), 7.37 (d, 2H), 7.46 - 7.56 (m, 3H), 7.92 (td, 1H), 8.23 (d, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.71 (s a, 1H).
A105		¹ H RMN (500 MHz, D ₂ O) δ (delta) 1.79 - 1.95 (m, 1 H), 2.34 (s, 5 H), 2.86 - 2.96 (m, 1 H), 2.98 - 3.15 (m, 1 H), 3.56 - 3.77 (m, 2 H), 7.23 - 7.28 (m, 1 H), 7.24 (s, 2 H), 8.12 - 8.30 (m, 1 H), 8.56 - 8.67 (m, 1 H), 8.70 - 8.81 (m, 1 H), 8.86 - 9.07 (m, 1 H)
A106		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 1.82 (s a, 1 H), 2.14 - 2.35 (m, 1 H), 2.50 - 2.70 (m, 1 H), 2.84 - 3.21 (m, 2 H), 3.25 - 3.42 (m, 1 H), 3.53 - 3.76 (m, 1 H), 7.20 (s, 2 H), 7.54 - 7.73 (m, 3 H), 7.54 - 7.73 (m, 2 H), 7.85 - 8.01 (m, 1 H), 8.31 - 8.47 (m, 1 H), 8.66 - 9.01 (m, 1 H)

A107		
A108		

Los compuestos adicionales de la **Tabla A3** siguiente ilustran la presente invención y son realizaciones particulares de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención. En su mayor parte, estos compuestos se pueden preparar por lo general mediante métodos similares a los que se muestran en los Ejemplos y/o en la sección de los procesos anterior de la presente utilizando materiales de partida adecuados y con cualesquiera cambios adecuados y/o necesarios en los procesos.

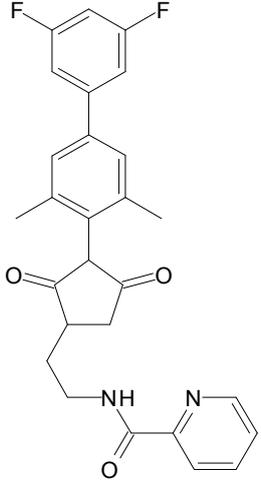
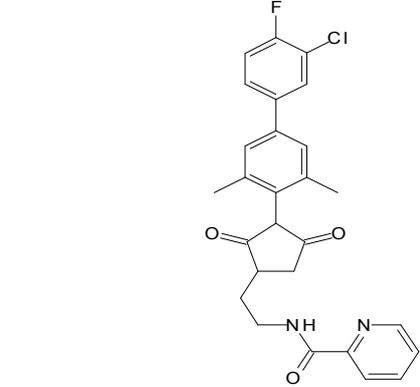
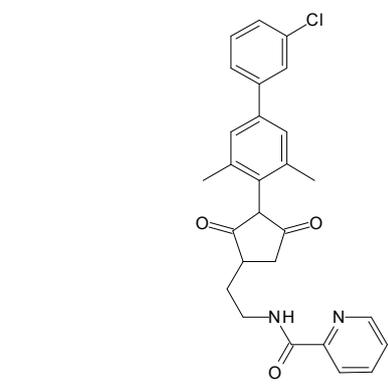
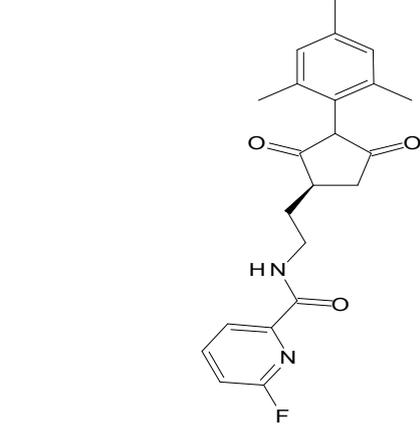
5

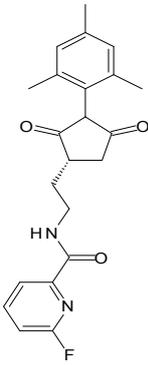
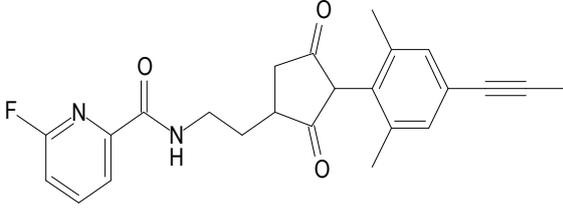
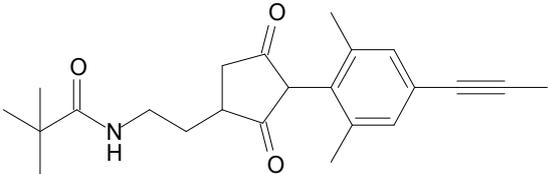
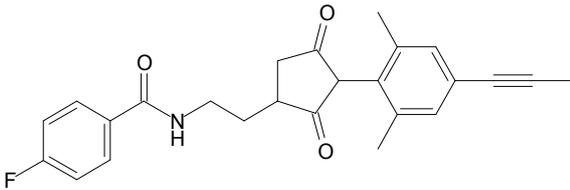
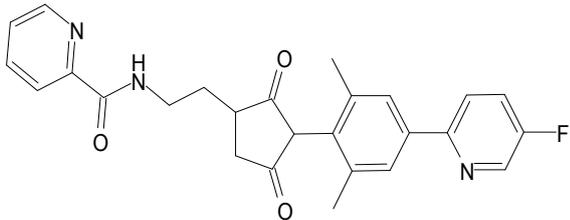
Cabe señalar que ciertos compuestos de la invención existen como una mezcla de isómeros, incluidos los atropisómeros, lo cual se indicó anteriormente, en las condiciones empleadas para obtener los datos de ^1H RMN. En los casos en los que esto ha sucedido, los datos de caracterización se proporcionan para todos los isómeros presentes a temperatura ambiente en el disolvente especificado. A menos que se indique lo contrario, los espectros de protón (^1H) de RMN se registraron a temperatura ambiente.

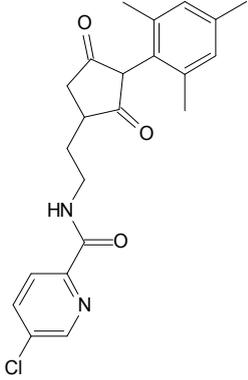
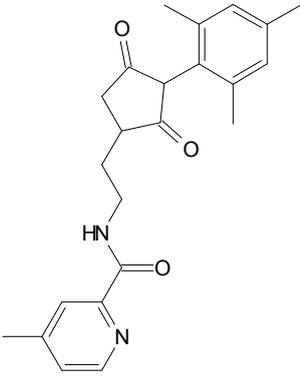
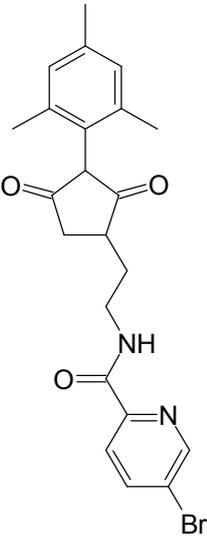
10

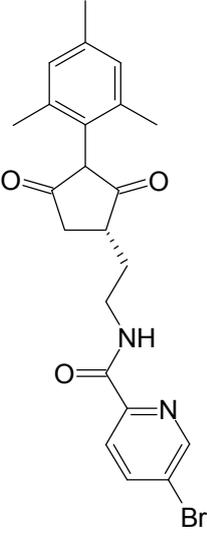
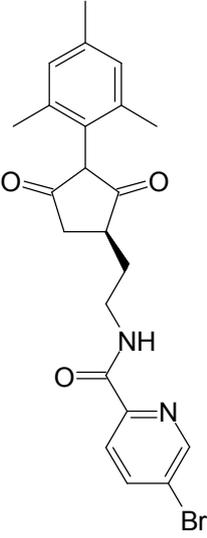
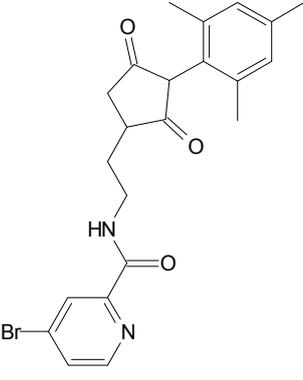
Tabla A3

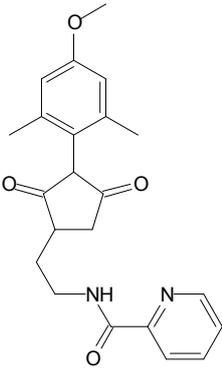
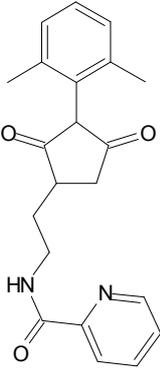
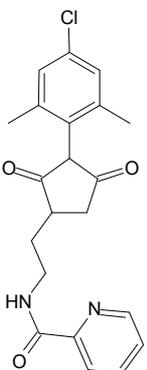
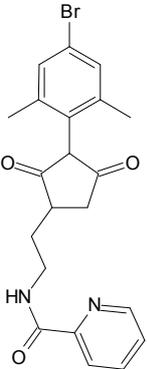
Número de compuesto	Estructura	Datos
---------------------	------------	-------

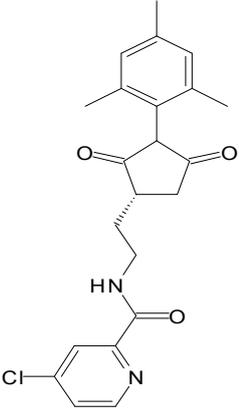
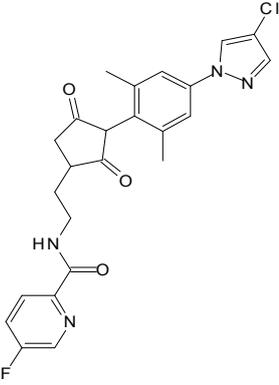
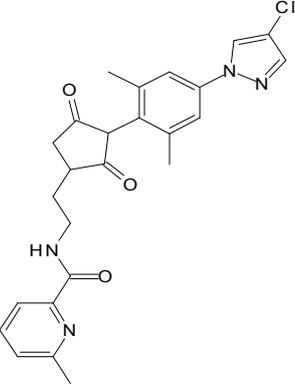
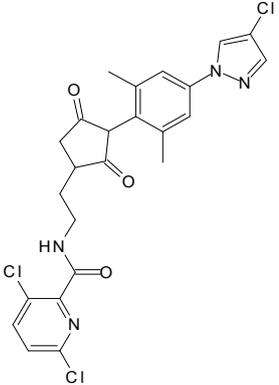
A109		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 2.00 (s, 2H), 2.04-2.15 (m, 1H), 2.16-2.36 (m, 6H), 2.91 (m, 2H), 3.48 (d, 1H), 4.00 (s a, 1H), 6.65-6.80 (m, 1H), 7.06 (d, 2H), 7.22 (s, 2H), 7.49 (m, 1H), 7.74-8.01 (m, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.63 (s a, 1H)
A110		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.83-1.99 (m, 1H), 2.10-2.39 (m, 8H), 2.77-3.14 (m, 2H), 3.32-3.58 (m, 1H), 3.82-4.47 (m, 1H), 7.15 (t, 1H), 7.20 (s, 2H), 7.35-7.43 (m, 1H), 7.49 (s a, 1H), 7.53-7.64 (m, 1H), 7.76-7.99 (m, 1H), 8.17 (s a, 1H), 8.49-8.64 (m, 1H), 8.64-8.84 (m, 1H)
A111		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.98 (s a, 1H), 2.10 (s a, 1H), 2.21 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.26-2.34 (m, 1H), 2.81-3.03 (m, 2H), 3.37-3.57 (m, 1H), 4.01 (s a, 1H), 7.24 (s, 2H), 7.28 (s, 1H), 7.29-7.36 (m, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.88 (t, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.62 (s a, 1H)
A112		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.79 - 2.50 (m, 13H), 2.88 (d, 2H), 3.29 - 3.53 (m, 1H), 6.89 (s, 2H), 7.05 - 7.22 (m, 1H), 7.81 - 8.19 (m, 2H), 8.19 - 8.39 (m, 1H)

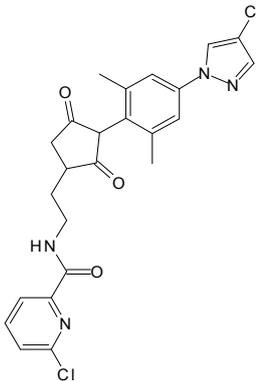
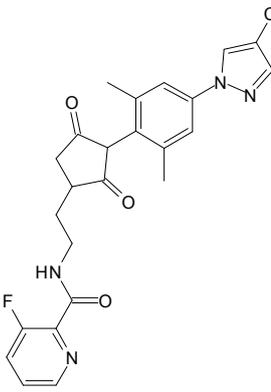
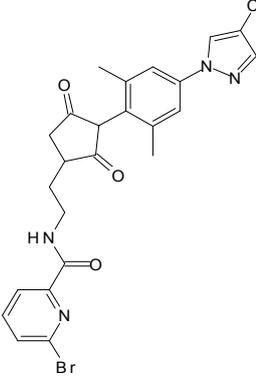
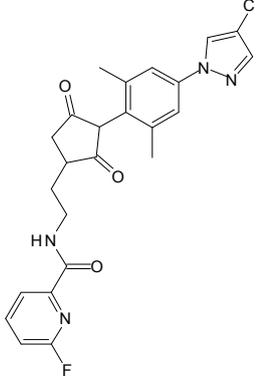
A113		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.79 - 2.50 (m, 13H), 2.88 (d, 2H), 3.29 - 3.53 (m, 1H), 6.89 (s, 2H), 7.05 - 7.22 (m, 1H), 7.81 - 8.19 (m, 2H), 8.19 - 8.39 (m, 1H)
A114		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.80-2.16 (m, 11H), 2.16-2.33 (m, 1H), 2.71-2.93 (m, 2H), 3.38-3.57 (m, 1H), 3.64-3.90 (m, 1H), 6.95-7.22 (m, 3H), 7.86-8.11 (m, 2H), 8.21 (s a, 1H)
A115		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.27 (d, 9H), 1.91-2.22 (m, 11H), 2.86 (s, 2H), 3.09-3.23 (m, 1H), 3.85-4.06 (m, 1H), 6.18-6.37 (m, 1H), 7.09 (s a, 1H), 7.16-7.24 (m, 1H)
A116		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.76-2.12 (m, 11H), 2.13-2.37 (m, 1H), 2.66-2.98 (m, 2H), 3.16-3.41 (m, 1H), 3.70 (d, 1H), 6.91-7.17 (m, 4H), 7.75 (ddd, 2H), 7.86 (s a, 1H)
A117		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.90-2.09 (m, 2H), 2.12-2.36 (m, 7H), 2.73-3.05 (m, 2H), 3.36-3.61 (m, 1H), 3.66-4.17 (m, 1H), 7.36-7.49 (m, 2H), 7.53 (s a, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.85 (t, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.45 (s a, 1H), 8.48-8.67 (m, 2H)

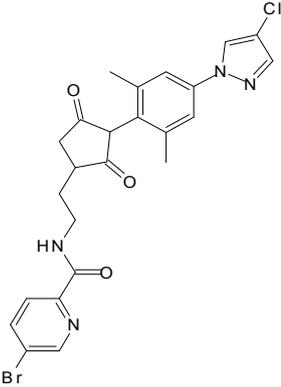
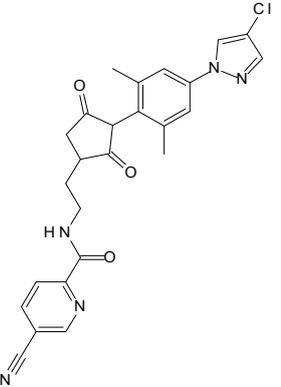
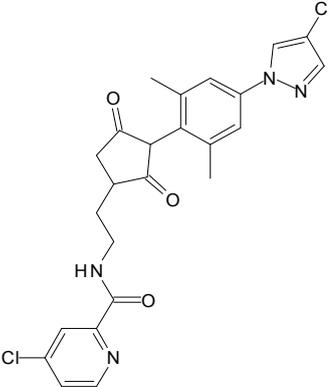
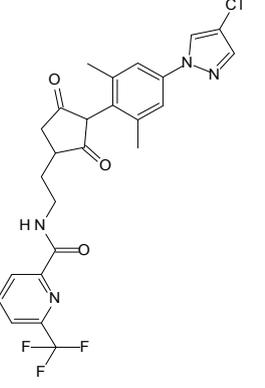
A118		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.61-3.03 (m, 13H), 3.20-3.77 (m, 2H), 3.77-4.06 (m, 1H), 6.83 (s, 2H), 7.65-8.63 (m, 4H)
A119		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.65-3.11 (m, 17H), 3.24-3.69 (m, 1H), 3.88-4.30 (m, 1H), 6.86 (s, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.89-8.20 (m, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.48-8.79 (m, 1H)
A120		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.83-2.4 (m, 11H), 2.74-3.11 (m, 2H), 3.45-3.52 (m, 2H), 3.97 (s a, 1H), 6.84 (s a, 2H), 7.9-8.09 (m, 2H), 8.48-8.7 (m, 2H)

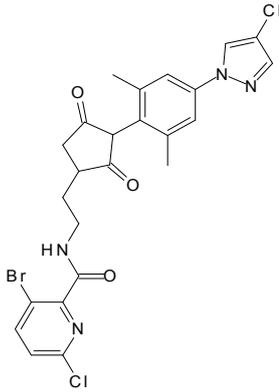
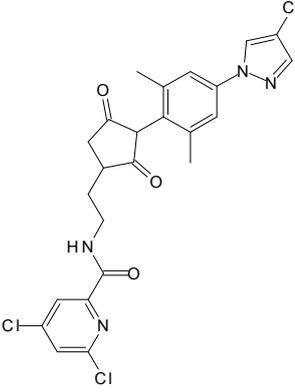
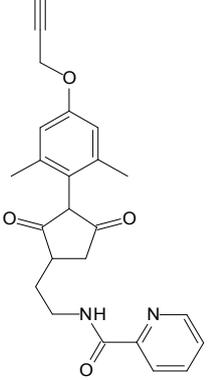
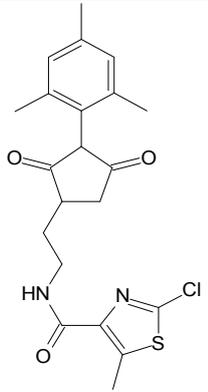
A120A		1H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.83-2.4 (m, 11H), 2.74-3.11 (m, 2H), 3.45- 3.52 (m, 2H), 3.97 (s a, 1H), 6.84 (s a, 2H), 7.9-8.09 (m, 2H), 8.48-8.7 (m, 2H)
A120B		1H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.83-2.4 (m, 11H), 2.74-3.11 (m, 2H), 3.45- 3.52 (m, 2H), 3.97 (s a, 1H), 6.84 (s a, 2H), 7.9-8.09 (m, 2H), 8.48-8.7 (m, 2H)
A121		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ (delta) 1.48-2.30 (m, 11H), 2.75-3.08 (m, 2H), 3.29-3.69 (m, 2H), 3.97 (s a, 1H), 6.84 (s a, 2H), 7.33- 7.81 (m, 1H), 7.90-8.71 (m, 3H)

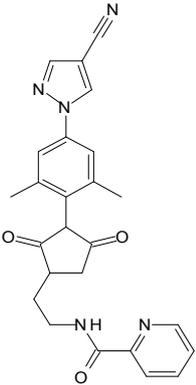
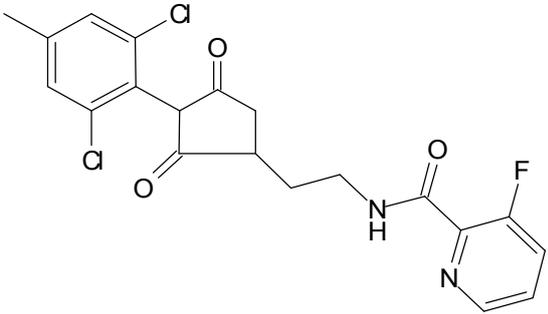
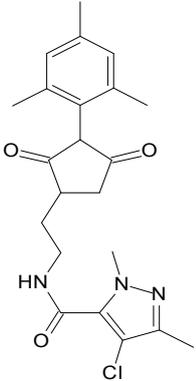
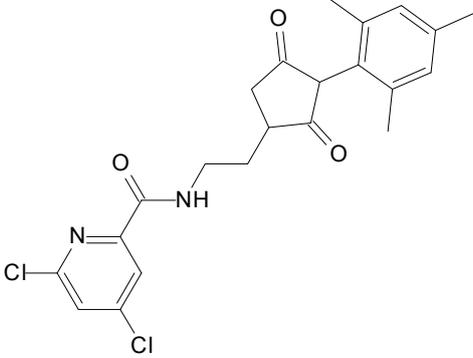
A122		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.87-2.05 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 2.18-2.33 (m, 1H), 2.74- 2.97 (m, 2H), 3.39-3.57 (m, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.91 (s a, 1H), 6.59 (s, 2H), 7.36-7.57 (m, 1H), 7.87 (t, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.40-8.72 (m, 2H)
A123		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_6 - DMSO), δ (delta) 1.51-1.64 (m, 1H), 2.01 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 2.04-2.14 (m, 1H), 2.38 (dd, 1H), 2.57-2.71 (m, 1H), 2.78-2.93 (m, 1H), 3.35-3.50 (m, 2H), 6.96- 7.03 (m, 2H), 7.03-7.12 (m, 1H), 7.61 (ddd, 1H), 7.94- 8.11 (m, 2H), 8.65 (d, 1H), 8.94 (t, 1H)
A124		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.81 - 1.90 (m, 1H), 2.08 (d, 1H), 2.14 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.19 - 2.25 (m, 1H), 2.84 - 2.92 (m, 1H), 2.92 - 3.00 (m, 1H), 3.37 - 3.47 (m, 1H), 4.13 - 4.23 (m, 1H), 7.07 (s, 2H), 7.48 - 7.58 (m, 1H), 7.92 (td, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.71 (s a, 1H), 12.52 (s a, 1H)
A125		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.85 (t, 1H), 2.09 - 2.12 (m, 1H), 2.14 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.29 (m, 1H), 2.82 - 3.04 (m, 2H), 3.42 (d, 1H), 4.14 - 4.25 (m, 1H), 7.22 (s, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.92 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.71 (s a, 1H), 12.53 (s a, 1H)

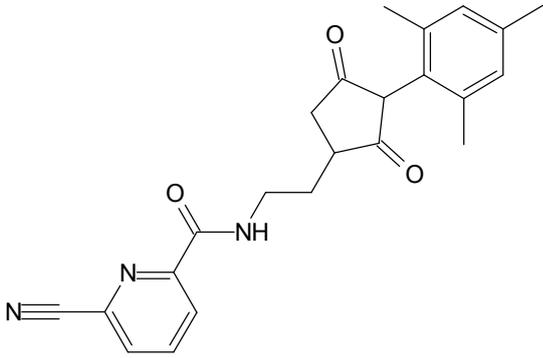
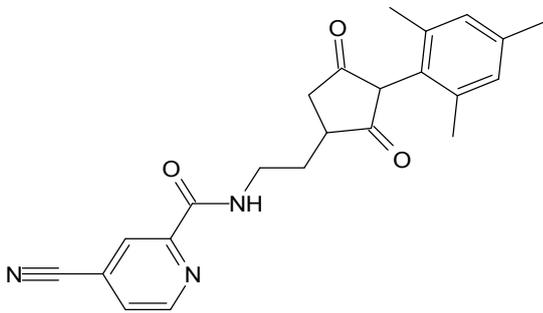
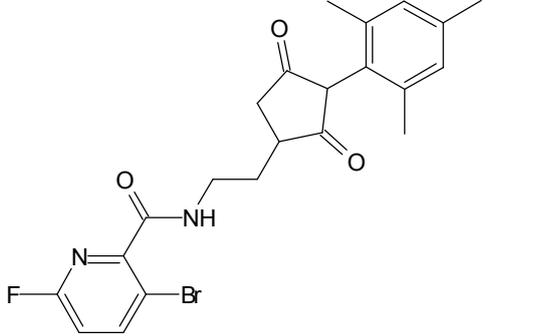
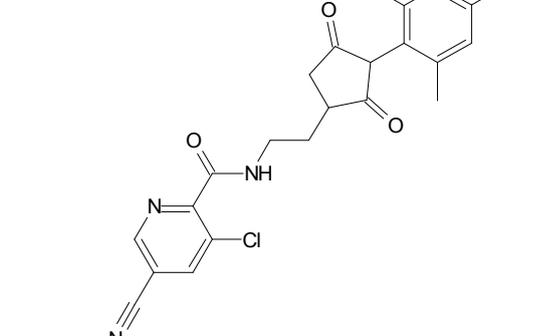
A128		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.77 - 2.43 (m, 12H), 2.67 - 3.17 (m, 2H), 3.26 - 3.87 (m, 2H), 6.89 (s, 2H), 7.45 - 7.57 (m, 1H), 8.07 - 8.68 (m, 3H)
A129		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.67-2.47 (m, 9H), 2.67-3.09 (m, 2H), 3.37-3.62 (m, 1H), 3.79-4.08 (m, 1H), 7.27 (d, 2H), 7.45-7.66 (m, 2H), 7.84 (s, 1H), 8.19 (s a, 1H), 8.28-8.64 (m, 1.5H), 11.5-13 (s a, 0.5H).
A130		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.76-1.99 (m, 1H), 2.08-2.43 (m, 8H), 2.60 (s, 3H), 2.75-3.10 (m, 2H), 3.47 (d, 1H), 4.12 (c, 1H), 7.28-7.42 (m, 3H), 7.60 (s, 1H), 7.67-8.06 (m, 3H), 8.71 (s a, 1H)
A131		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.76-1.95 (m, 1H), 1.95-2.18 (m, 7H), 2.18-2.43 (m, 1H), 2.65-2.99 (m, 2H), 3.36-3.55 (m, 1H), 3.54-3.83 (m, 1H), 7.18 (s, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.65-7.86 (m, 2H), 7.96-8.33 (m, 1H)

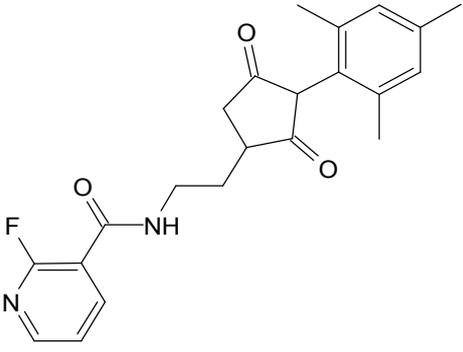
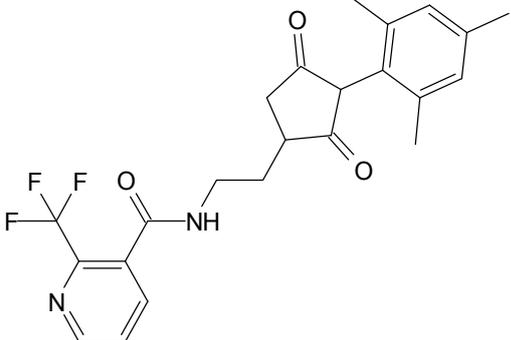
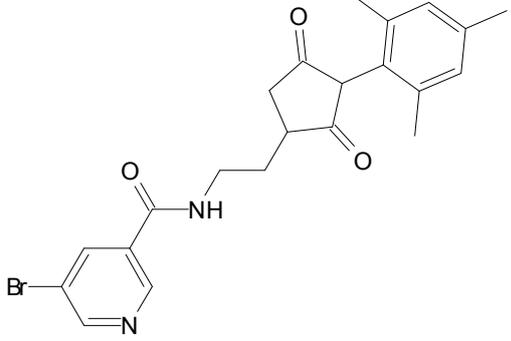
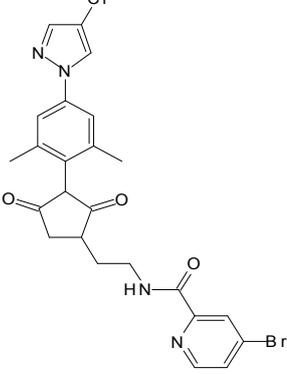
A132		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.55-2.47 (m, 9H), 2.61-3.06 (m, 2H), 3.27- 3.60 (m, 1H), 3.60-4.06 (m, 1H), 7.23 (s, 2H), 7.40-8.13 (m, 5H), 8.14-8.65 (m, 1H)
A133		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.77-2.22 (m, 8H), 2.22-2.48 (m, 1H), 2.92 (m, 2H), 3.40-3.59 (m, 1H), 3.58-4.00 (m, 1H), 7.20 (d, 2H), 7.31-7.63 (m, 3H), 7.81 (s, 1H), 8.15-8.53 (m, 2H)
A134		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.82-2.42 (m, 9H), 2.87 (m, 2H), 3.32-3.59 (m, 1H), 3.69-4.05 (m, 1H), 7.25-7.4 (s, 2H), 7.54-7.94 (m, 4H), 8.10 (d, 1H), 8.20- 8.54 (m, 1H)
A135		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.87-2.02 (m, 2H), 2.07-2.47 (m, 7H), 2.69- 3.05 (m, 2H), 3.48 (d, 1H), 3.64-4.01 (m, 1H), 6.84- 7.37 (m, 3H), 7.57 (s, 1H), 7.72-8.45 (m, 4H)

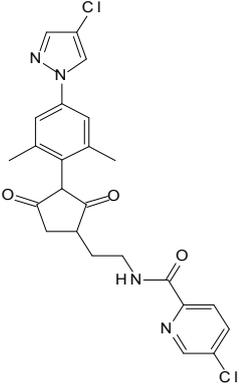
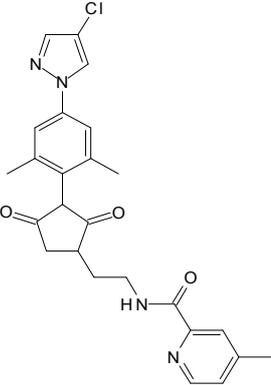
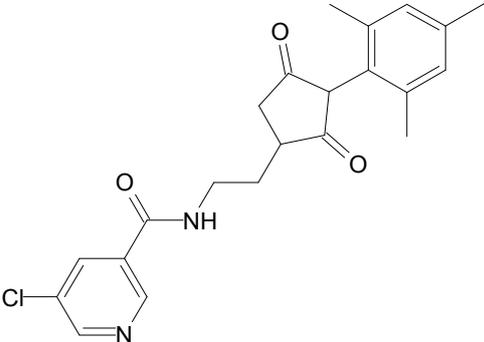
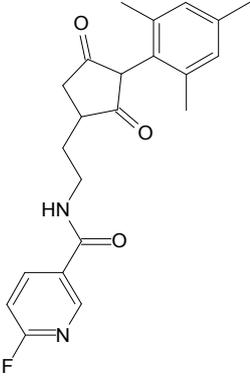
A136		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.52-2.57 (m, 8H), 2.57-3.19 (m, 2H), 3.19-3.80 (m, 2H), 3.80-4.22 (m, 1H), 6.97-7.46 (m, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.88-8.35 (m, 2H), 8.35-8.85 (m, 2H), 11.84-12.62 (m, 1H)
A137		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.56-2.7 (m, 8H), 2.7-3.02 (s a, 2H), 3.54 (s a, 2H), 3.74-4.06 (m, 1H), 7.03-7.33 (m, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.97-9.02 (m, 3.5H), 11.89 (s a, 0.5H)
A138		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.58-2.57 (m, 9H), 2.89 (dd, 2H), 3.25-4.30 (m, 2H), 7.2-7.3 (s, 2H), 7.40-7.70 (m, 2H), 7.74-7.97 (m, 1H), 8.16 (s a, 1H), 8.36-8.73 (m, 1.5H), 11.52-12.52 (m, 0.5H)
A139		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.51-2.58 (m, 9H), 2.62-3.20 (m, 2H), 3.28-3.82 (m, 1H), 3.84-4.29 (m, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 7.47-7.67 (m, 1H), 7.68-7.96 (m, 2H), 8.10 (s a, 1H), 8.38 (s a, 1H), 8.55 (s a, 0.5H), 11.49-12.53 (m, 0.5H)

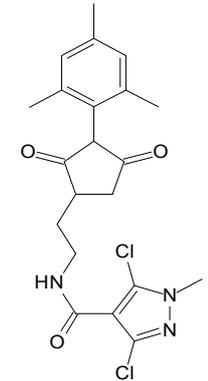
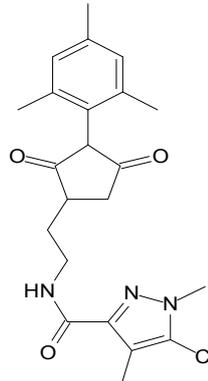
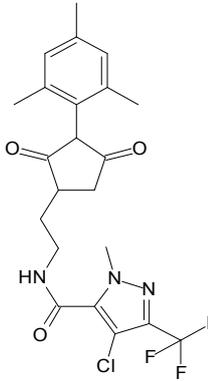
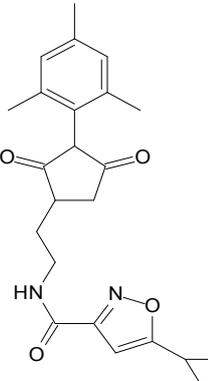
A140		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.72-2.52 (m, 9H), 2.60-3.10 (m, 2H), 3.47 (m, 1H), 3.62-3.90 (m, 1H), 6.99-7.38 (m, 3H), 7.55 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.89-8.04 (m, 1H), 8.08-8.32 (m, 1H)
A141		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.68-2.50 (m, 9H), 2.73-3.10 (m, 2H), 3.38-3.62 (m, 1H), 3.86-4.27 (m, 1H), 7.12-7.42 (m, 2H), 7.45-7.60 (s, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.00-8.19 (m, 1H), 8.21-8.54 (m, 0.5H), 11.5-13.5 (m, 0.5H).
A141A		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.93-2.07 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.18-2.33 (m, 1H), 2.50 (t, 1H), 2.75-3.03 (m, 2H), 3.37-3.59 (m, 1H), 3.92 (s, 1H), 4.62 (s, 2H), 6.66 (s, 2H), 7.37-7.59 (m, 1H), 7.87 (t, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.57 (d, 2H)
A142		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 1.79 (ddt, 1 H), 2.18 (s, 6 H), 2.20-2.27 (m, 1 H), 2.55 (dd, 1 H), 2.81-2.90 (m, 1 H), 2.99 (dd, 1 H), 3.54-3.68 (m, 2 H), 7.48 (s, 2 H), 7.54 (d, 1 H), 7.95 (t, 1 H), 8.07 (s, 1 H), 8.10 (d, 1 H), 8.62 (s, 1 H), 8.84 (s, 1 H).

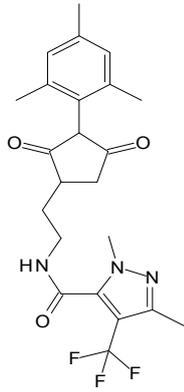
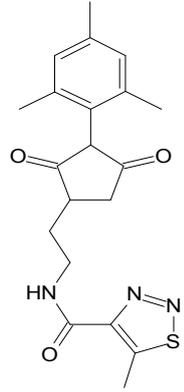
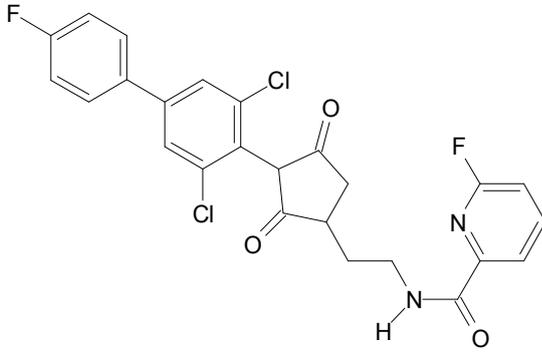
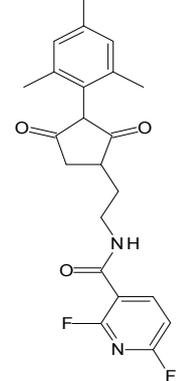
A143		^1H RMN (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.76 (2H, s), 3.39 (2H, t), 2.86-2.78 (1H, m), 2.72-2.62 (1H, m), 2.65 (3H, s), 2.37 (1H, d), 2.14 (3H, s), 2.10-2.02 (1H, m), 1.94 (6H, s), 1.64-1.55 (1H, m)
A144		^1H RMN (500 MHz, D_2O) δ (delta) 1.70 - 1.85 (m, 1 H), 2.08 - 2.21 (m, 1 H), 2.29 (s, 4 H), 2.65 - 2.82 (m, 2 H), 3.45 - 3.61 (m, 2 H), 7.14 - 7.39 (m, 3 H), 7.82 - 7.96 (m, 1 H), 8.01 - 8.25 (m, 1 H)
A145		^1H RMN (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 3.72 (3H, s), 3.45-3.33 (2H, m), 2.87-2.78 (1H, m), 2.72-2.65 (1H, m), 2.38 (1H, m), 2.18 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.09-2.02 (1H, m), 1.94 (6H, s), 1.65-1.54 (1H, m)
A146		^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ (delta) 2.00-2.35 (m, 12H), 2.90 (s, 2H), 3.38-3.53 (m, 1H), 4.12 (d, 1H), 6.89 (s, 2H), 7.41-7.63 (m, 1H), 8.04-8.20 (m, 1H), 8.25-8.43 (m, 1H)

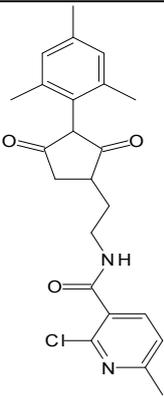
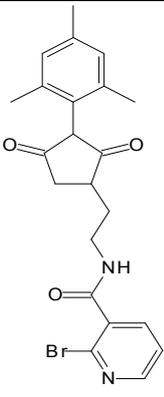
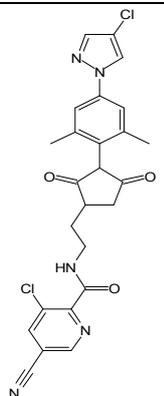
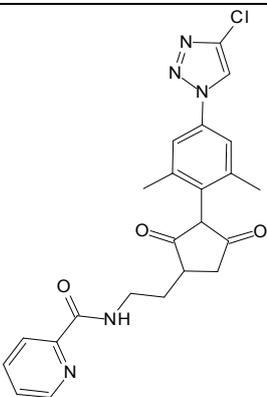
A147		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.85-2.16 (m, 8H), 2.23 (s, 4H), 2.85 (d, 2H), 3.36-3.68 (m, 1H), 3.68-3.99 (m, 1H), 6.84 (s, 2H), 8.05 (s, 4H)
A148		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.82-2.16 (m, 8H), 2.22 (s, 4H), 2.64-2.95 (m, 2H), 3.42-3.67 (m, 1H), 3.68-3.96 (m, 1H), 6.73-6.96 (m, 2H), 7.60-7.76 (m, 1H), 8.25-8.51 (m, 2H), 8.69-8.83 (m, 1H)
A149		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.75-1.95 (m, 1H), 1.95-2.13 (m, 7H), 2.22 (s, 4H), 2.81 (d, 2H), 3.30-3.53 (m, 1H), 3.53-3.81 (m, 1H), 6.82 (s, 2H), 6.96 (dd, 1H), 8.07 (dd, 2H)
A150		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.62-1.93 (m, 1H), 1.93-2.09 (m, 7H), 2.19 (s, 4H), 2.56-2.85 (m, 2H), 3.37-3.71 (m, 2H), 6.78 (s, 2H), 8.05 (d, 1H), 8.18-8.36 (m, 1H), 8.61 (d, 1H)

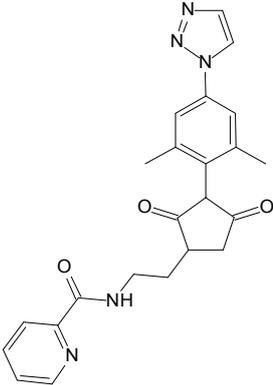
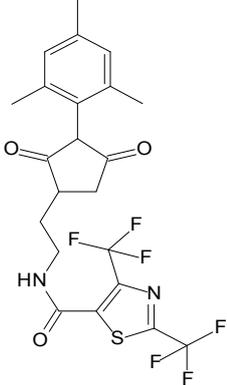
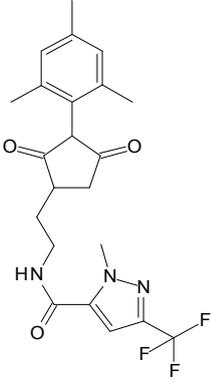
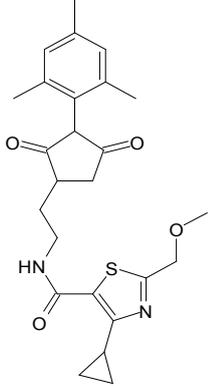
A151		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.70-2.39 (m, 12H), 2.57-2.98 (m, 2H), 3.33-3.66 (m, 1H), 3.70-4.01 (m, 1H), 6.83 (s, 2H), 7.30-7.41 (m, 1H), 7.41-7.58 (m, 1H), 8.18-8.38 (m, 1H), 8.39-8.59 (m, 1H)
A152		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.68-2.10 (m, 8H), 2.22-2.35 (s, 4H), 2.57-2.98 (m, 2H), 3.21-3.52 (m, 1H), 3.52-3.69 (m, 1H), 6.82 (s, 2H), 7.29-7.82 (m, 3H), 8.52-8.75 (m, 1H)
A153		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.81 - 2.25 (m, 11H), 2.25 - 2.48 (m, 1H), 2.73 - 2.88 (m, 1H), 2.88 - 3.05 (m, 1H), 3.25 - 3.51 (m, 1H), 3.63 - 3.85 (m, 1H), 6.79 (d, 2H), 8.07 - 8.48 (m, 3H), 8.80 (d, 1H)
A154		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.60-2.56 (m, 8H), 2.58-3.12 (m, 2H), 3.29-3.69 (m, 2H), 3.87-4.27 (m, 1H), 7.29 (s a, 2H), 7.59 (s, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.24-8.47 (m, 2H), 8.47-8.78 (m, 1H)

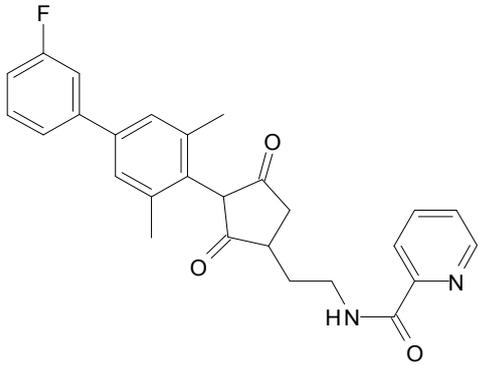
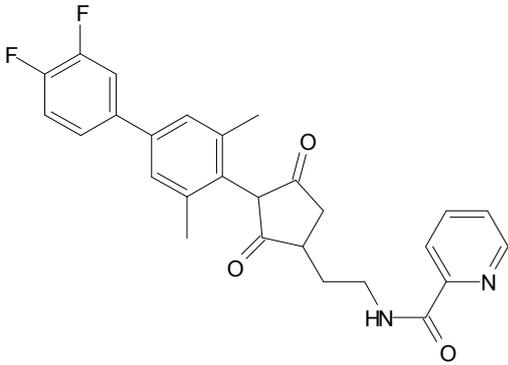
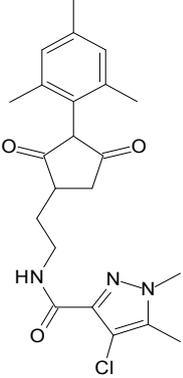
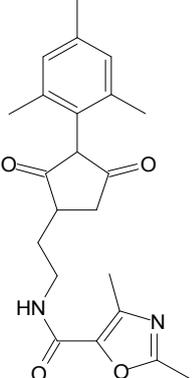
A155		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.56 - 2.33 (m, 9H), 2.56 - 3.05 (m, 2H), 3.4-3.6 (s a, 1.5H), 3.76 - 4.07 (m, 0.5H), 7.07 - 7.36 (m, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.66 - 7.89 (m, 2H), 8.09 (d, 1H), 8.33 - 8.76 (m, 2H)
A156		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.68-2.4 (m, 9H), 2.4-2.6 (s, 3H), 2.97 (d, 2H), 3.26-3.65 (m, 1H), 3.86-4.18 (m, 1H), 7.15-7.49 (m, 3H), 7.61 (s a, 1H), 7.86 (s a, 1H), 8.04 (s a, 1H), 8.25-8.63 (m, 1H), 8.63-8.98 (m, 1H)
A157		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.76-1.97 (m, 2H), 1.97-2.10 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.24-2.50 (m, 1H), 2.59-3.09 (m, 2H), 3.16-3.58 (m, 1H), 3.59-3.73 (m, 1H), 6.76 (d, 2H), 7.92-8.58 (m, 3H), 8.74 (d, 1H)
A158		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.54-2.53 (m, 12H), 2.55-3.18 (m, 2H), 3.18-3.67 (m, 1H), 3.63-3.89 (m, 1H), 6.83 (d, 2H), 6.87-6.95 (m, 1H), 8.17-8.32 (m, 1H), 8.58-8.80 (m, 1H)

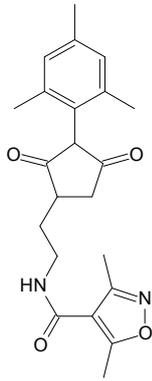
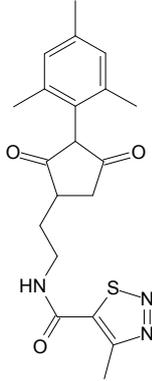
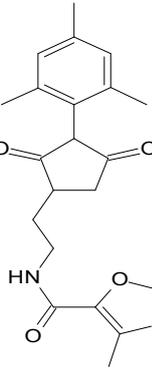
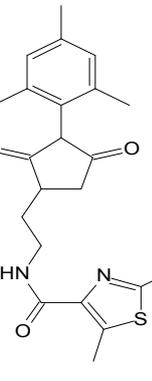
A159		¹ H RMN (500 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 6.89 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.61-3.99 (2H, m), 3.01-2.92 (1H, m), 2.88 (1H, a), 2.51 (1H, D) 2.28 (3H, s), 2.24-2.14 (1H, m), 2.07 (6H, s), 1.79-1.69 (1H, m)
A160		¹ H RMN (500 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 3.76 (3H, s), 3.39 (t, 2H), 2.87-2.78 (1H, m), 2.73-2.64 (m a, 1H), 2.38 (1H, D) 2.15 (3H, s), 2.12 (3H, s), 2.09-2.02 (1H, m), 1.94 (6H, s), 1.64-1.06 (1H, m)
A161		¹ H RMN (500 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 3.92 (3H, s), 3.51-3.41 (2H, m), 2.88-2.80 (1H, m), 2.75-2.68 (1H, m a), 2.38 (1H, D) 2.14 (3H, s), 2.13-2.04 (1H, m), 1.93 (6H, s), 1.68-1.58 (1H, m)
A162		¹ H RMN (500 MHz, d ₄ -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 6.26 (1H, s), 3.47-3.34 (2H, m), 2.86-2.77 (1H, m), 2.70-2.62 (1H, m a), 2.37 (1H, D) 2.13 (3H, s), 2.10-2.00 (2H, m), 1.93 (6H, s), 1.63-1.53 (1H, m), 1.04-0.98 (2H, m), 0.88-0.81 (2H, m)

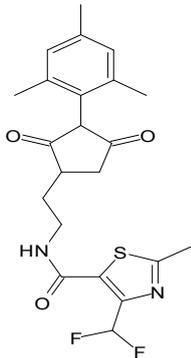
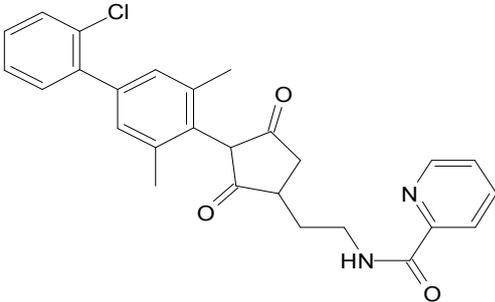
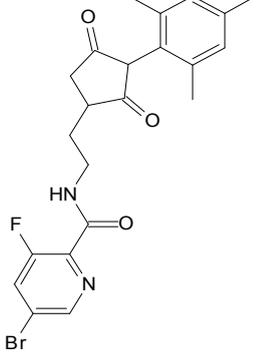
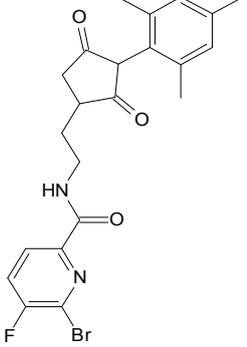
A163		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.77 (2H, s), 3.70 (3H, s), 3.49-3.37 (2H, m), 2.87-2.79 (1H, m), 2.72-2.65 (1H, m a), 2.38 (1H, D) 2.19 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.12-2.02 (1H, m), 1.94 (6H, s), 1.65-1.55 (1H, m)
A164		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 3.49 (2H, t), 2.88-2.81 (1H, m), 2.79 (3H, s), 2.76-2.69 (1H, m a), 2.40 (1H, D) 2.17-2.08 (1H, m), 2.13 (3H, s), 1.93 (6H, s), 1.70-1.61 (1H, m)
A165		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.89 - 2.03 (m, 1 H), 2.17 (s a, 2 H), 2.84 - 3.05 (m, 2 H), 3.33 - 3.55 (m, 1 H), 4.12 - 4.28 (m, 1 H), 7.13 (s, 2 H), 7.51 (s, 4 H), 7.96 - 8.21 (m, 3 H), 8.28 - 8.48 (m, 1 H)
A166		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.71-1.89 (m, 1H), 1.89-2.27 (m, 10H), 2.42 (dd, 1H), 2.65-2.99 (m, 2H), 3.50-3.66 (m, 2H), 6.86 (s, 2H), 6.97 (dd, 1H), 7.77-7.97 (m, 1H), 8.50 (d, 1H)

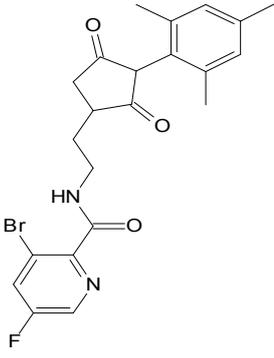
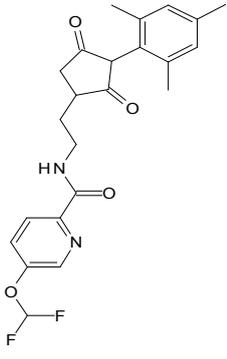
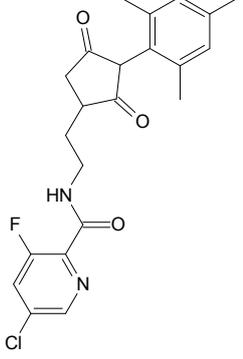
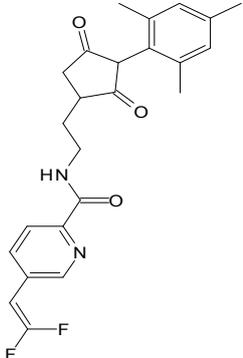
A167		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.73-2.02 (m, 8H), 2.11-2.35 (m, 4H), 2.42-2.60 (m, 3H), 2.61-2.93 (m, 2H), 3.25-3.74 (m, 2H), 6.79 (s, 2H), 7.06 (d, 1H), 7.62-7.85 (m, 2H)
A168		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 2.00 (d, 8H), 2.20 (s, 4H), 2.60-2.93 (m, 2H), 3.29-3.49 (m, 1H), 3.49-3.73 (m, 1H), 6.79 (s, 2H), 7.20 (dd, 1H), 7.78 (d, 2H), 8.29 (dd, 1H)
A169		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, CDCl_3) δ (delta) 1.90-2.54 (m, 9H), 2.81-3.10 (m, 2H), 3.39-4.06 (m, 2H), 7.19-7.40 (m, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.78-7.90 (m, 1H), 7.93-8.46 (m, 2H), 8.58-8.88 (m, 1H)
A170		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 1.74-1.86 (m, 1H), 2.18 (s, 6H), 2.20-2.28 (m, 1H), 2.56 (dd, 1H), 2.83-2.91 (m, 1H), 3.00 (dd, 1H), 3.56-3.67 (m, 2H), 7.49 (s, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.94 (t, 1H), 8.09 (d, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.61 (d, 1H)

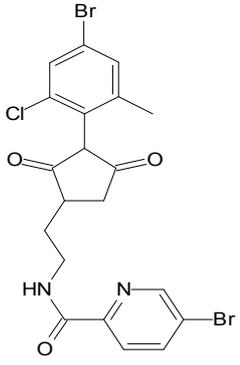
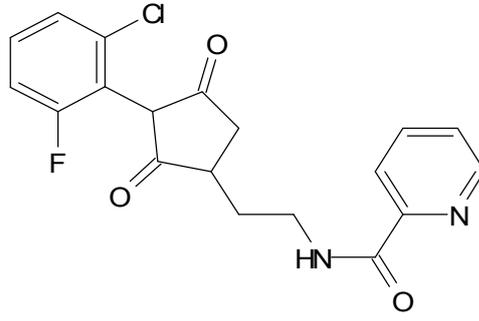
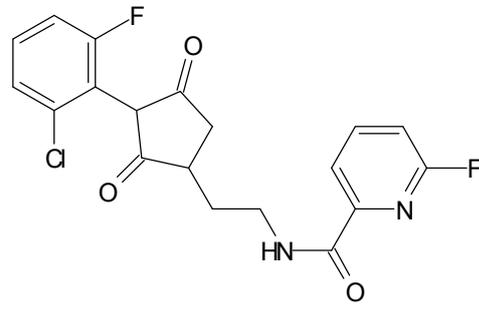
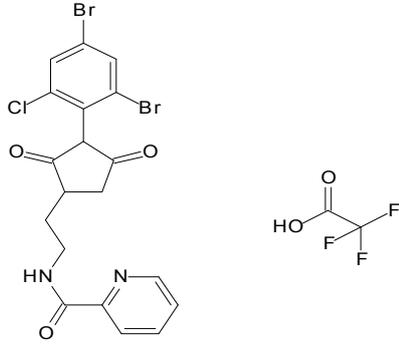
A171		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 1.75-1.85 (m, 1H), 2.20 (s, 6H), 2.22-2.28 (m, 1H), 2.51-2.60 (m, 1H), 2.81-2.91 (m, 1H), 2.95-3.05 (m, 1H), 3.57-3.67 (m, 2H), 7.51-7.57 (m, 3H), 7.87 (d, 1H), 7.95 (td, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.63 (d, 1H)
A172		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.75 (2H, s), 3.52-3.38 (2H, m), 2.89-2.79 (1H, m), 2.74-2.65 (1H, m a), 2.38 (1H, D) 2.14 (3H, s), 2.12-2.02 (1H, m), 1.95 (6H, s), 1.69-1.57 (1H, m)
A173		$^1\text{H RMN}$ (500 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.97 (1H, s), 6.73 (2H, s), 4.04 (3H, s), 3.38 (2H, t), 2.88-2.78 (1H, m), 2.72-2.63 (1H, m a), 2.37 (1H, D) 2.13 (3H, s), 2.11-2.01 (1H, m), 1.93 (6H, s), 1.68-1.53 (1H, m)
A174		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 4.49 (2H, s), 3.39 (2H, t), 3.34 (3H, s), 2.88-2.78 (1H, m), 2.72-2.62 (1H, m), 2.62-2.52 (1H, m), 2.37 (1H, D) 2.13 (3H, s), 2.10-2.01 (1H, m), 1.94 (6H, s), 1.68-1.56 (1H, m), 0.89 (4H, d)

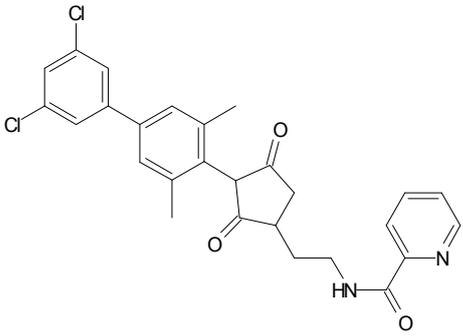
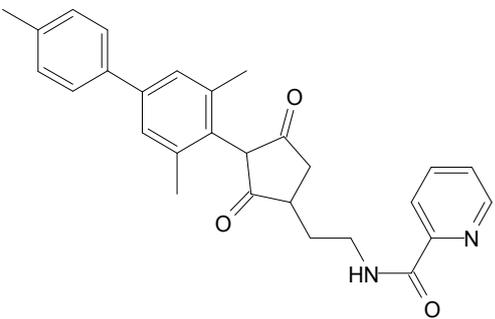
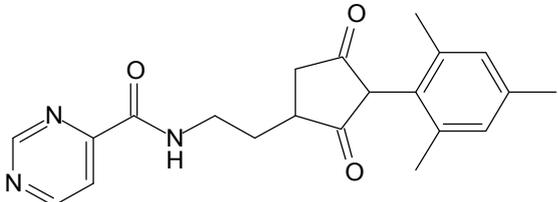
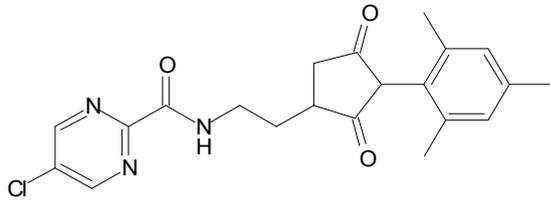
A175		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 1.66 - 1.84 (m, 2 H), 2.24 (d, 6 H), 2.73 (s, 2 H), 3.27 - 3.39 (m, 1 H), 3.55 - 3.65 (m, 2 H), 6.95 - 7.10 (m, 1 H), 7.29 (s a, 3 H), 7.37 - 7.48 (m, 2 H), 7.50 - 7.68 (m, 1 H), 7.89 - 7.99 (m, 1 H), 8.06 - 8.24 (m, 1 H), 8.49 - 8.79 (m, 1 H)
A176		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 1.77 (ddt, 1 H), 2.19 (s, 7 H), 2.42 (dd, 1 H), 2.63 - 2.96 (m, 2 H), 3.55 - 3.75 (m, 3 H), 7.18 - 7.63 (m, 6 H), 7.86 - 8.01 (m, 1 H), 8.10 (d, 1 H), 8.50 - 8.78 (m, 1 H)
A177		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.73 (2H, s), 3.72 (3H, s), 3.43-3.35 (2H, m), 2.87-2.79 (1H, m), 2.73-2.64 (1H, m a), 2.38 (1H, D) 2.17 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.09-2.00 (1H, m), 1.93 (6H, s), 1.65-1.54 (1H, m)
A178		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.74 (2H, s), 3.38 (2H, t), 2.87-2.78 (1H, m), 2.72-2.63 (1H, s a), 2.38 (1H, d) 2.37 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.10-2.00 (1H, m), 1.92 (6H, s), 1.66-1.53 (1H, m)

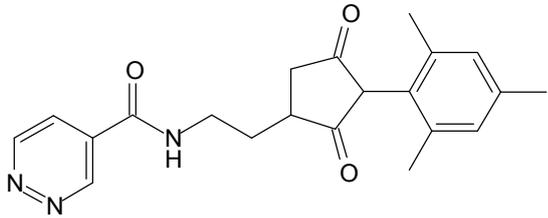
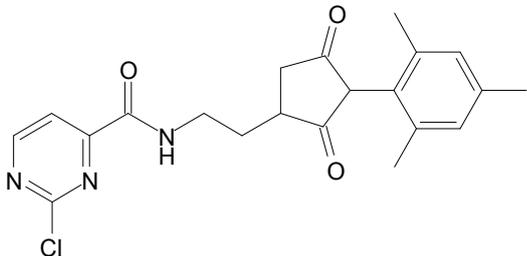
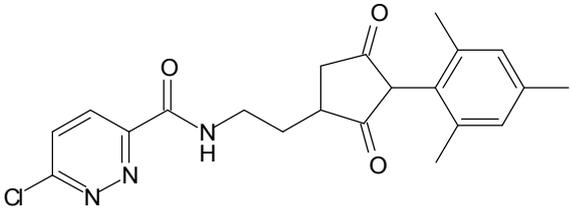
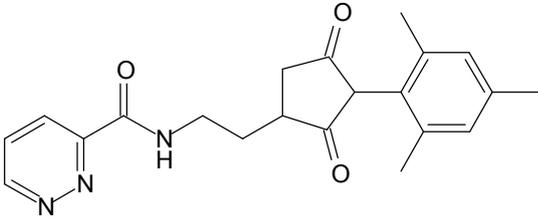
A179		
A180		
A181		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 8.02 (1H, s), 6.72 (2H, s), 3.38 (2H, t), 2.87-2.77 (1H, m), 2.72-2.61 (1H, m), 2.36 (1H, d), 2.33 (3H, s), 2.12 (3H, s), 2.08-1.99 (1H, m), 1.92 (6H, s), 1.64-1.52 (1H, m)
A182		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 6.73 (2H, s), 3.35 (2H, t), 2.87-2.78 (1H, m), 2.70-2.61 (1H, m), 2.53 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.36 (1H, d), 2.12 (3H, s), 2.07-1.98 (1H, m), 1.93 (6H, s), 1.65-1.53 (1H, m)

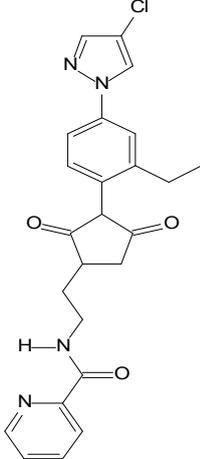
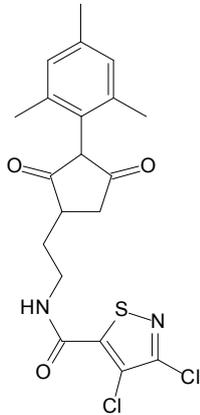
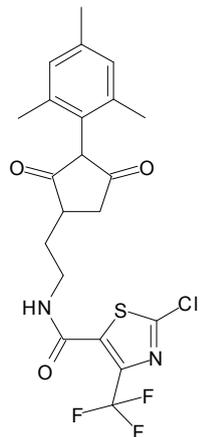
A183		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ 7.33 (1H, t), 6.88 (2H, s), 3.51 (2H, t), 3.00-2.90 (1H, m), 2.83-2.72 (1H, m), 2.74 (3H, s), 2.49 (1H, d), 2.26 (3H, s), 2.22-2.11 (1H, m), 2.04 (6H, s), 1.79-1.67 (1H, m)
A184		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3OD) δ 1.66-1.86 (m, 1H), 2.19-2.26 (m, 6H), 2.33 (dd, 1H), 2.61-2.79 (m, 2H), 3.33 (dt, 1H), 3.63 (t, 2H), 7.10 (s, 2H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.43-7.49 (m, 1H), 7.54 (ddd, 1H), 7.96 (td, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.65 (d, 1H)
A185		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3CN) δ 1.68-1.86 (m, 1H), 1.91-2.12 (m, 7H), 2.24 (s, 4H), 2.68-2.92 (m, 2H), 3.35-3.68 (m, 2H), 6.85 (s, 2H), 7.95 (dd, 1H), 8.13-8.34 (m, 1H), 8.46-8.60 (m, 1H)
A186		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3CN) δ 1.73-1.90 (m, 1H), 1.93-2.13 (m, 7H), 2.26 (s, 4H), 2.67-2.92 (m, 2H), 3.37-3.74 (m, 2H), 6.87 (s, 2H), 7.74 (t, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.21-8.53 (m, 1H)

A187		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 1.80 (m, 1H), 1.90-2.47 (m, 11H), 2.65-2.98 (m, 2H), 3.50 (s, 2H), 6.89 (s, 2H), 7.98 (dd, 2H), 8.48 (d, 1H)
A188		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3CN) δ 8.47 (d, 2H), 8.15 (d, 1H), 7.70 (dd, 1H), 6.69-7.19 (m, 3H), 3.58-3.80 (m, 1H), 3.39-3.58 (m, 1H), 2.80 (s a, 2H), 2.26 (s, 4H), 1.73-2.13 (m, 8H)
A189		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3CN) δ 8.36-8.54 (m, 1H), 8.13-8.36 (m, 1H), 7.73-7.89 (m, 1H), 6.85 (s, 2H), 3.26-3.73 (m, 2H), 2.63-2.92 (m, 2H), 2.24 (s, 4H), 1.93-2.11 (m, 7H), 1.70-1.86 (m, 1H)
A190		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.48 (s, 2H), 8.13 (d, 1H), 7.84 (dd, 1H), 6.86 (s, 2H), 5.25-5.48 (m, 1H), 3.73-4.06 (m, 1H), 3.48 (s a, 1H), 2.74-2.97 (m, 2H), 1.74-2.37 (m, 12H)

A199		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, d_4 -metanol) δ 8.57 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 3.53-3.41 (m, 2H), 2.90-2.77 (m, 1H), 2.76-2.68 (m, 1H), 2.46-2.37 (m, 1H), 2.14-2.01 (m, 1H), 2.02 (s, 3H), 1.74-1.58 (m, 1H)
A200		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3OD) δ 1.64-1.90 (m, 1H), 2.14-2.38 (m, 2H), 2.61-2.82 (m, 2H), 3.55-3.65 (m, 2H), 6.93-7.07 (m, 1H), 7.22 (d, 2H), 7.47-7.61 (m, 1H), 7.90-8.01 (m, 1H), 8.05-8.15 (m, 1H), 8.57-8.74 (m, 1H)
A201		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3OD) δ 1.68-1.89 (m, 1H), 2.10-2.22 (m, 1H), 2.24-2.36 (m, 1H), 2.58-2.81 (m, 2H), 3.79-3.85 (m, 2H), 6.89-7.08 (m, 2H), 7.15-7.28 (m, 2H), 7.43 (d, 1H), 7.69 (dd, 1H)
A202	<p style="text-align: center;">sal trifluoroacetato</p> 	$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CD_3OD) δ 8.62 (s, 1H), 8.12 (d, 1H), 8.00 (t, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.71-7.53 (m, 2H), 3.68-3.53 (m, 2H), 3.03-2.40 (m, 1H), 2.40-2.80 (m, 1H), 2.53 (d, 1H), 2.27-2.13 (m, 1H), 1.89-1.73 (m, 1H)

A203		¹ H RMN (400 MHz, CD ₃ OD) δ 1.66-1.84 (m, 1H), 2.24 (d, 6H), 2.28-2.39 (m, 1H), 2.58-2.69 (m, 1H), 2.71-2.82 (m, 1H), 3.30-3.34 (m, 1H), 3.62 (t, 2H), 7.28 (s, 2H), 7.36 (t, 1H), 7.48-7.60 (m, 3H), 7.95 (td, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.64 (d, 1H)
A204		¹ H RMN (400 MHz, CD ₃ OD) δ 1.66-1.85 (m, 1H), 2.16-2.25 (m, 7H), 2.29-2.42 (m, 3H), 2.60-2.82 (m, 2H), 3.54-3.73 (m, 3H), 7.15-7.63 (m, 7H), 7.96 (td, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.65 (d, 1H)
A205		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 9.39 - 9.27 (m, 1H), 9.13 - 8.93 (m, 1H), 8.24 - 8.07 (m, 1H), 6.86 (s, 2H), 3.71 - 3.53 (m, 2H), 3.03 - 2.87 (m, 1H), 2.87 - 2.74 (m, 1H), 2.59 - 2.44 (m, 1H), 2.25 (s, 4H), 2.04 (s, 7H), 1.85 - 1.69 (m, 1H)
A206		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 8.97 (s, 2H), 6.86 (s, 2H), 3.72 - 3.51 (m, 2H), 3.02 - 2.87 (m, 1H), 2.87 - 2.69 (m, 1H), 2.60 - 2.40 (m, 1H), 2.25 (s, 4H), 2.09 - 1.95 (m, 7H), 1.84 - 1.65 (m, 1H)

A207		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 9.96 - 9.83 (m, 1H), 9.75 - 9.67 (m, 1H), 8.83 - 8.58 (m, 1H), 6.87 (s, 2H), 3.71 - 3.54 (m, 2H), 3.08 - 2.93 (m, 1H), 2.93 - 2.77 (m, 1H), 2.60 - 2.40 (m, 1H), 2.25 (s, 4H), 2.12 - 1.96 (m, 7H), 1.88 - 1.69 (m, 1H)
A208		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 8.90 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 6.85 (s, 2H), 3.58 (s, 2H), 3.02 - 2.87 (m, 1H), 2.87 - 2.68 (m, 1H), 2.56 - 2.46 (m, 1H), 2.24 (s, 4H), 2.09 - 1.97 (m, 7H), 1.82 - 1.67 (m, 1H)
A209		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 8.36 - 8.24 (m, 1H), 8.08 - 7.73 (m, 1H), 6.88 (s, 2H), 3.73 - 3.48 (m, 2H), 3.05 - 2.89 (m, 1H), 2.89 - 2.72 (m, 1H), 2.63 - 2.41 (m, 1H), 2.27 (s, 4H), 2.11 - 1.95 (m, 7H), 1.86 - 1.68 (m, 1H)
A210		¹ H RMN (400 MHz, d ₄ -metanol) δ 9.64 - 9.39 (m, 1H), 8.72 - 8.55 (m, 1H), 8.43 - 8.00 (m, 1H), 6.96 - 6.61 (m, 2H), 3.70 - 3.60 (m, 2H), 3.02 - 2.90 (m, 1H), 2.90 - 2.77 (m, 1H), 2.63 - 2.42 (m, 1H), 2.25 (s, 4H), 2.12 - 1.98 (m, 7H), 1.84 - 1.70 (m, 1H)

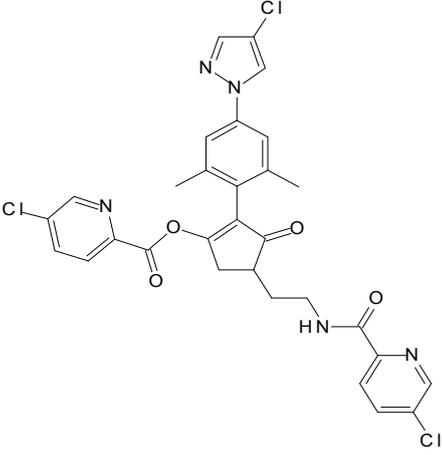
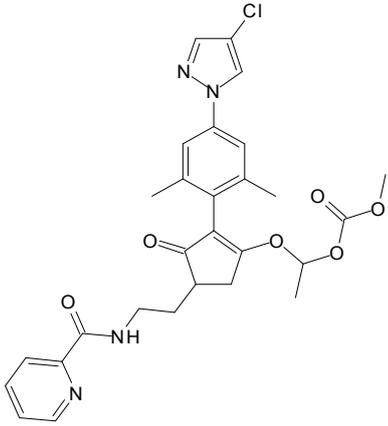
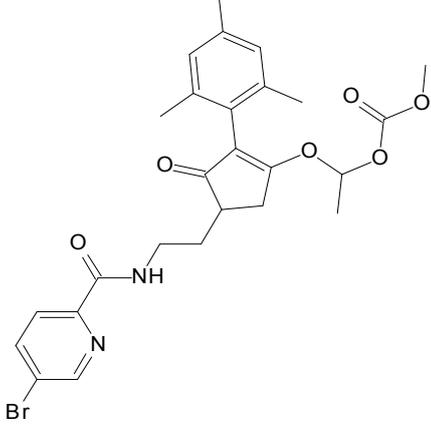
A211		^1H RMN (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 8.86 (d, 1H), 8.60 (dd, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.54 (dd, 1H), 7.14 (d, 1H), 3.73-3.63 (m, 2H), 3.01 (dd, 1H), 2.91-2.80 (m, 1H), 2.58 (dd, 1H), 2.57 (c, 2H), 2.30-2.20 (m, 1H), 1.93-1.78 (m, 1H), 1.16 (t, 3H)
A212		^1H RMN (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.76 (2H, s), 3.54-3.42 (2H, m), 2.90-2.77 (1H, m), 2.75-2.66 (1H, m), 2.39 (1H, d), 2.14 (3H, s), 2.12-2.03 (1H, m), 1.95 (6H, s), 1.72-1.61 (1H, m)
A213		^1H RMN (400 MHz, d_4 -metanol) δ (delta) 6.76 (2H, s), 3.47-3.33 (2H, m), 2.85-2.78 (1H, m), 2.71-2.63 (1H, m), 2.35 (1H, d), 2.14 (3H, s), 2.10-2.02 (1H, m), 1.95 (6H, s), 1.64-1.54 (1H, m)

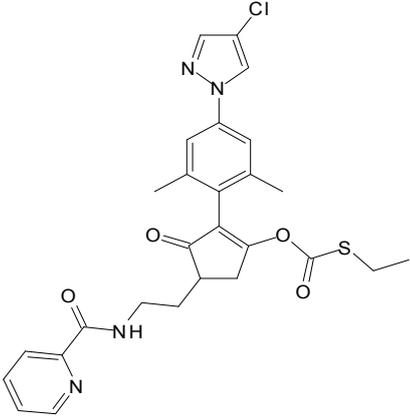
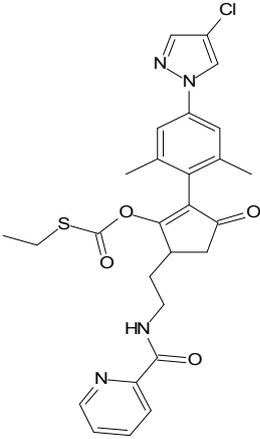
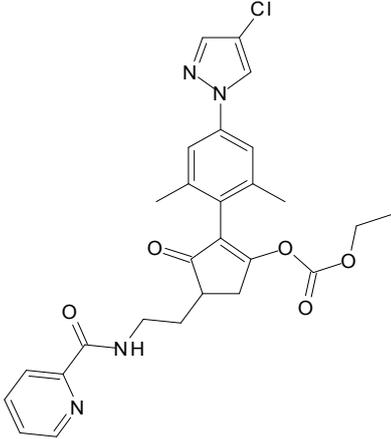
Los compuestos adicionales de la **Tabla P1** siguiente ilustran la presente invención y son realizaciones particulares de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención, en los que G no es hidrógeno. En su mayor parte, estos compuestos se pueden preparar por lo general mediante métodos similares a los que se muestran en los Ejemplos y/o en la sección de los procesos anterior de la presente utilizando materiales de partida adecuados y con cualesquiera cambios adecuados y/o necesarios en los procesos.

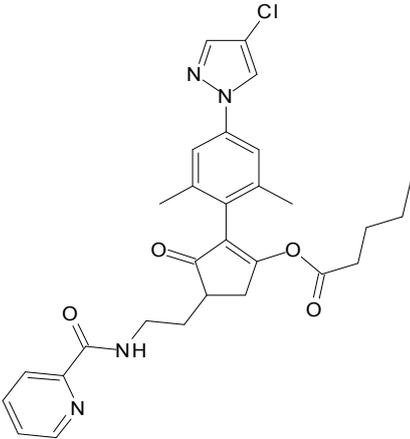
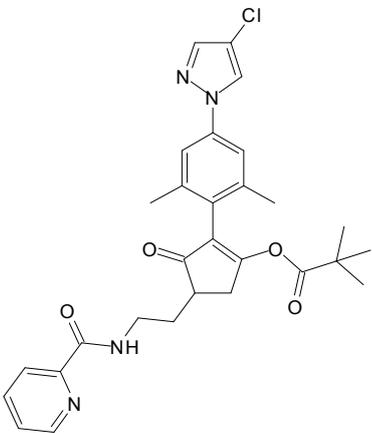
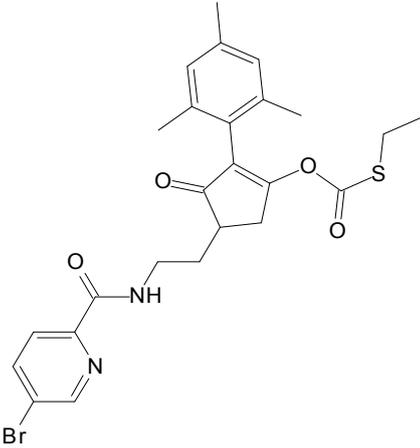
Cabe señalar que ciertos compuestos de la invención existen como una mezcla de isómeros, incluidos los atropisómeros, lo cual se indicó anteriormente, en las condiciones empleadas para obtener los datos de ^1H RMN. En los casos en los que esto ha sucedido, los datos de caracterización se proporcionan para todos los isómeros presentes a temperatura ambiente en el disolvente especificado. A menos que se indique lo contrario, los espectros

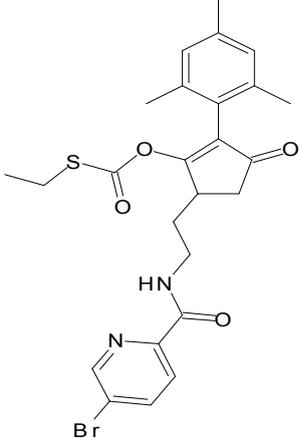
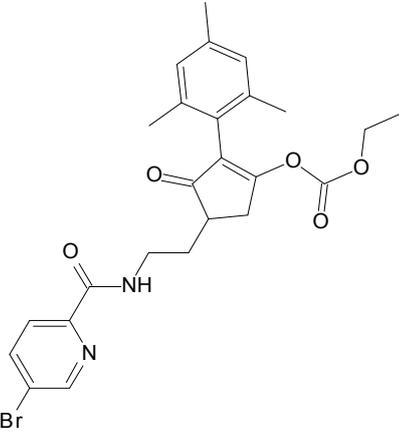
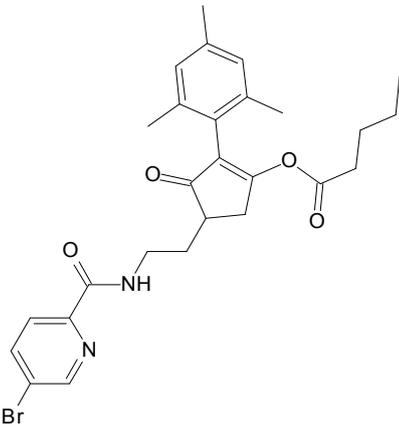
de protón (^1H) de RMN se registraron a temperatura ambiente.

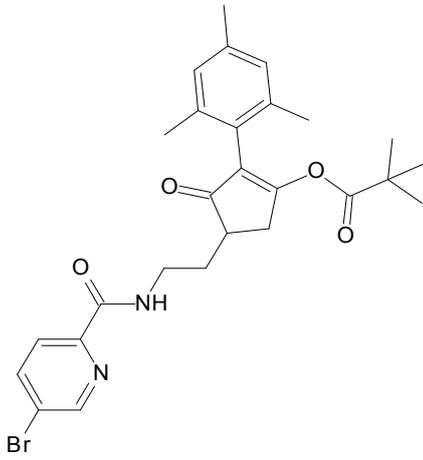
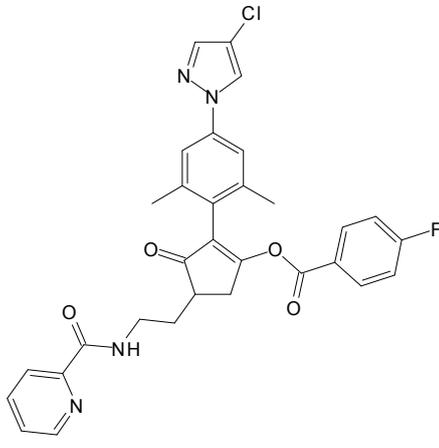
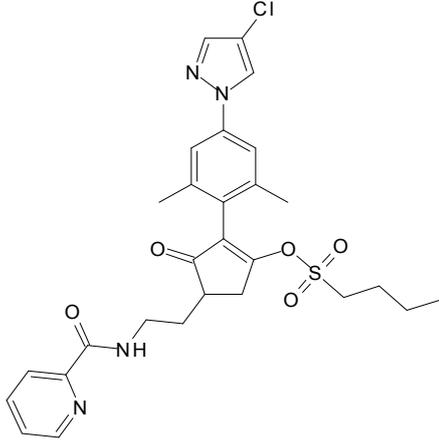
Tabla P1

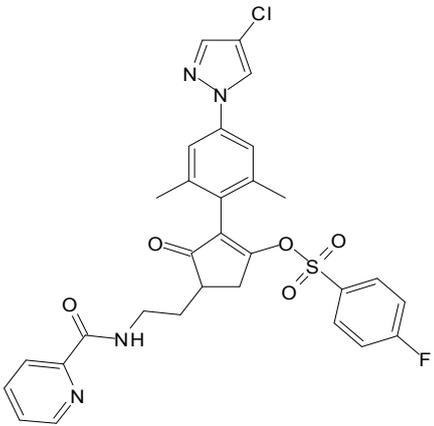
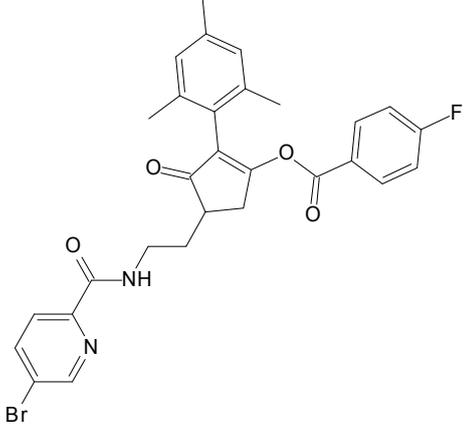
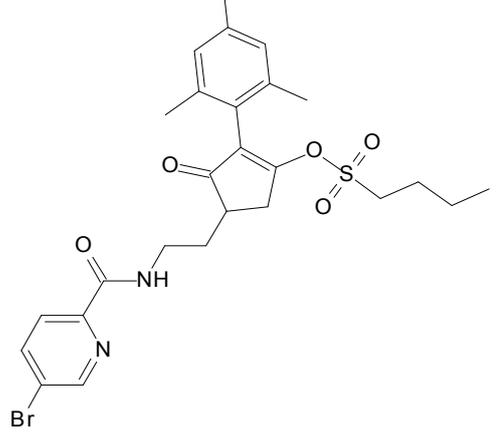
Número de compuesto	Estructura	Datos
P1		^1H RMN (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 1.84 - 2.02 (m, 1H), 2.06 - 2.37 (m, 7H), 2.88 - 3.21 (m, 2H), 3.32 - 3.88 (m, 3H), 7.20 - 7.42 (m, 2H), 7.48 - 7.98 (m, 5H), 8.04 - 8.23 (m, 2H), 8.39 - 8.74 (m, 2H)
P2		^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1.28-1.50 (m, 3H), 1.65 - 1.97 (m, 2H), 2.12 - 2.28 (m, 2H), 2.54 - 2.99 (m, 7H), 2.54 - 2.99 (m, 3H), 3.01 - 3.39 (m, 1H), 3.64 - 3.81 (m, 4H), 5.56 - 6.36 (m, 1H), 7.33 (s, 3H), 7.88 (s, 2H), 8.20 (s, 2H), 8.44 - 8.66 (m, 1H)
P3		^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.47 - 8.70 (m, 1H), 7.88 - 8.23 (m, 3H), 6.73 - 6.95 (m, 2H), 5.71 - 6.32 (m, 1H), 3.52 - 3.83 (m, 4H), 2.33 - 3.30 (m, 3H), 2.27 (s, 4H), 1.98 - 2.10 (m, 6H), 1.67 - 1.91 (m, 2H), 1.30 - 1.57 (m, 3H)

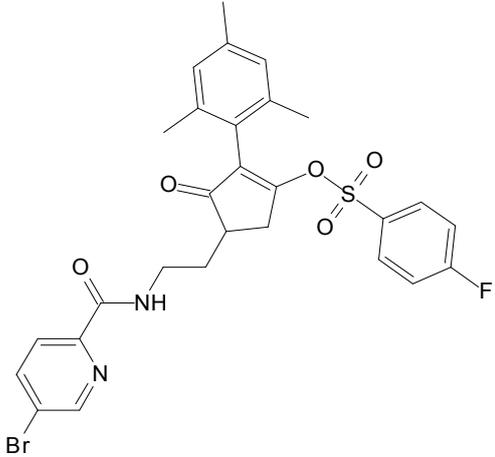
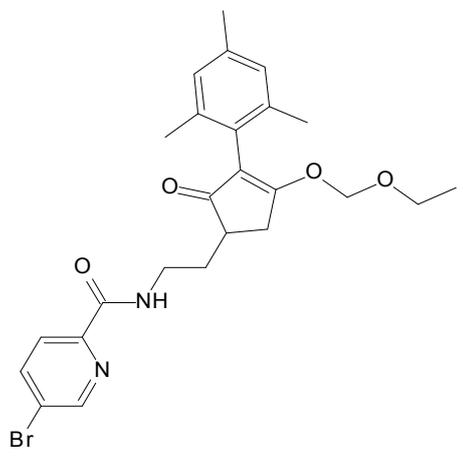
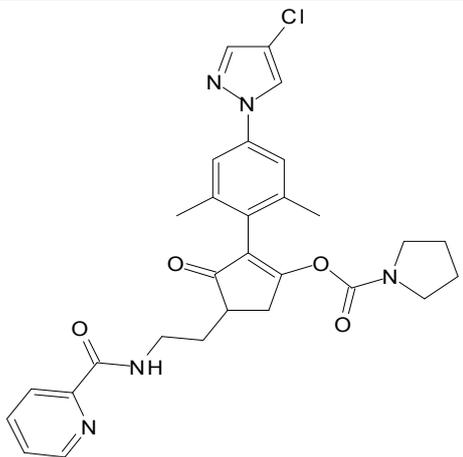
P4		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.55 (d, 1H), 8.19 (d, 2H), 7.75 - 7.95 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.39 - 7.52 (m, 1H), 7.33 (s, 2H), 3.53 - 3.86 (m, 2H), 3.32 - 3.53 (m, 1H), 2.77 - 3.02 (m, 4H), 2.21 - 2.36 (m, 1H), 2.09 - 2.21 (m, 6H), 1.83 - 1.93 (m, 1H), 1.19 - 1.36 (m, 3H)
P5		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.46 - 8.60 (m, 1H), 8.09 - 8.29 (m, 2H), 7.75 - 7.95 (m, 2H), 7.55 - 7.68 (m, 1H), 7.41 - 7.51 (m, 1H), 7.29 - 7.37 (m, 2H), 3.57 - 3.75 (m, 2H), 3.32 - 3.51 (m, 1H), 2.87 - 3.11 (m, 1H), 2.65 - 2.81 (m, 2H), 2.45 - 2.63 (m, 1H), 2.17 (d, 7H), 1.68 - 1.86 (m, 1H), 1.14 (s, 3H)
P6		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.45 - 8.64 (m, 1H), 8.19 (d, 2H), 7.77 - 7.97 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.30 - 7.50 (m, 3H), 4.14 - 4.26 (m, 2H), 3.54 - 3.87 (m, 2H), 3.41 (dd, 1H), 2.97 (dd, 2H), 2.09 - 2.38 (m, 7H), 1.82 - 1.98 (m, 1H), 1.27 (c, 3H)

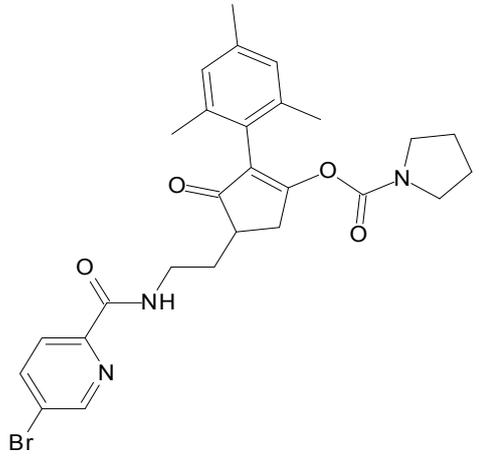
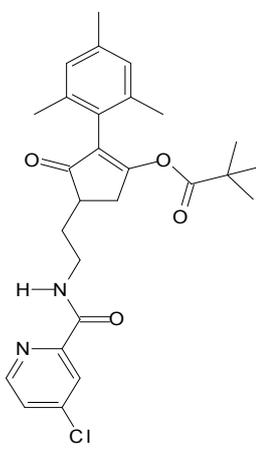
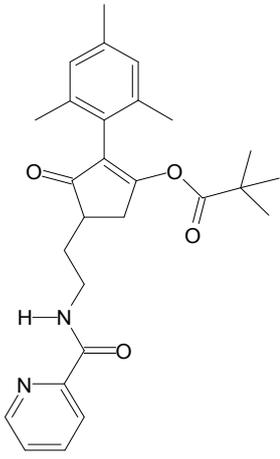
P7		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.56 (dd, 1H), 8.19 (d, 2H), 7.75 - 7.96 (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.39 - 7.51 (m, 1H), 7.33 (s, 2H), 3.52 - 3.88 (m, 2H), 3.20 - 3.40 (m, 1H), 2.87 (m, 2H), 2.36 (t, 2H), 2.08 - 2.31 (m, 7H), 1.79 - 1.96 (m, 1H), 1.43 - 1.60 (m, 2H), 1.10 - 1.30 (m, 2H), 0.82 (t, 3H)
P8		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.49 - 8.62 (m, 1H), 8.19 (d, 2H), 7.77 - 7.92 (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.40 - 7.51 (m, 1H), 7.33 (s, 2H), 3.50 - 3.87 (m, 2H), 3.20 - 3.36 (m, 1H), 2.75 - 2.95 (m, 2H), 2.21 - 2.37 (m, 1H), 2.15 (d, 6H), 1.78 - 1.98 (m, 1H), 1.10 (s, 9H)
P9		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.53 - 8.67 (m, 1H), 7.89 - 8.23 (m, 3H), 6.86 (s, 2H), 3.72 (s, 2H), 3.35 (dd, 1H), 2.73 - 2.99 (m, 4H), 2.26 (s, 4H), 1.97 - 2.11 (m, 6H), 1.78 - 1.94 (m, 1H), 1.18 - 1.32 (m, 3H)

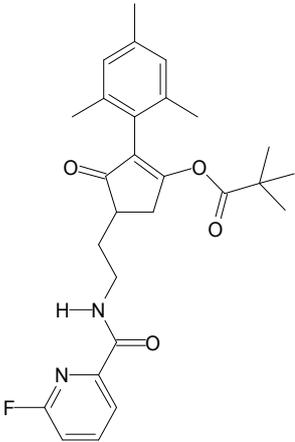
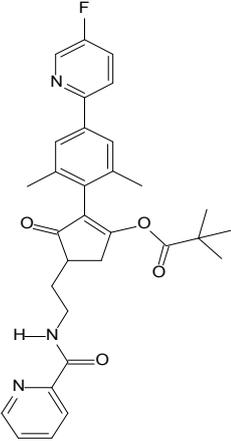
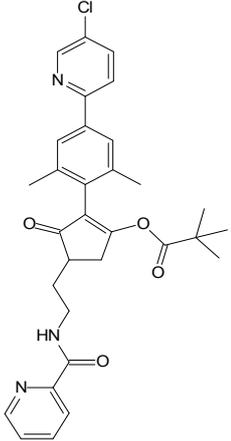
P10		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.61 (d, 1H), 7.87 - 8.18 (m, 3H), 6.85 (s, 2H), 3.51 - 3.68 (m, 2H), 3.37 - 3.50 (m, 1H), 2.90 - 3.05 (m, 1H), 2.75 (m, 2H), 2.41 - 2.57 (m, 1H), 2.16 - 2.35 (m, 4H), 1.99 - 2.14 (m, 6H), 1.66 - 1.84 (m, 1H), 1.13 (t, 3H)
P11		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.60 (d, 1H), 7.88 - 8.22 (m, 3H), 6.87 (s, 2H), 4.19 (c, 2H), 3.53 - 3.83 (m, 2H), 3.36 (dd, 1H), 2.92 (dd, 2H), 2.26 (s, 4H), 1.97 - 2.15 (m, 6H), 1.79 - 1.95 (m, 1H), 1.21 - 1.35 (m, 3H)
P12		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.60 (d, 1H), 7.90 - 8.26 (m, 3H), 6.86 (s, 2H), 3.48 - 3.88 (m, 2H), 3.27 (dd, 1H), 2.67 - 2.92 (m, 2H), 2.14 - 2.41 (m, 6H), 1.96 - 2.11 (m, 6H), 1.78 - 1.93 (m, 1H), 1.43 - 1.58 (m, 2H), 1.10 - 1.31 (m, 2H), 0.82 (t, 3H)

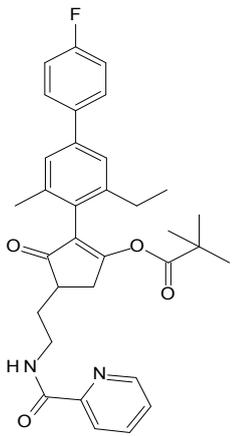
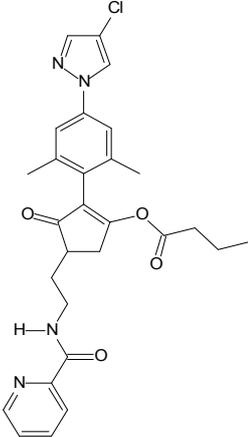
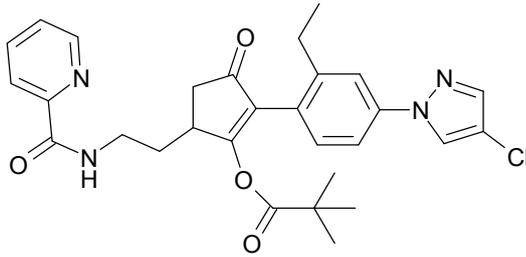
P13		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.54 - 8.67 (m, 1H), 7.87 - 8.22 (m, 3H), 6.71 - 6.90 (m, 2H), 3.47 - 3.85 (m, 2H), 3.11 - 3.34 (m, 1H), 2.63 - 2.92 (m, 2H), 2.25 (m, 4H), 1.97 - 2.13 (m, 6H), 1.76 - 1.94 (m, 1H), 1.09 (s, 9H)
P14		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.45 - 8.66 (m, 1H), 8.09 - 8.36 (m, 2H), 7.79 - 7.98 (m, 4H), 7.61 (s, 1H), 7.39 - 7.50 (m, 1H), 7.29 - 7.38 (m, 2H), 7.01 - 7.18 (m, 2H), 3.40 - 3.90 (m, 3H), 2.83 - 3.17 (m, 2H), 2.20 (d, 7H), 1.80 - 2.01 (m, 1H)
P15		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 0.71 - 0.86 (m, 3H), 1.18 - 1.40 (m, 2H), 1.55 - 1.71 (m, 2H), 1.91 (s, 1H), 2.07 - 2.37 (m, 7H), 2.75 - 3.22 (m, 4H), 3.47 (dd, 1H), 3.56 - 3.84 (m, 2H), 7.29 - 7.49 (m, 3H), 7.55 - 7.65 (s, 1H), 7.77 - 7.97 (m, 2H), 8.07 - 8.36 (m, 2H), 8.46 - 8.62 (m, 1H)

P16		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.46 - 8.67 (m, 1H), 8.20 (d, 2H), 7.87 (s, 2H), 7.74 (dd, 2H), 7.63 (s, 1H), 7.38 - 7.49 (m, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.03 - 7.18 (m, 2H), 3.52 - 3.83 (m, 2H), 3.32 - 3.52 (m, 1H), 2.79 - 3.05 (m, 2H), 2.15 - 2.31 (m, 1H), 1.95 - 2.08 (m, 6H), 1.80 - 1.95 (m, 1H)
P17		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.60 (d, 1H), 8.02 - 8.24 (m, 2H), 7.86 - 8.02 (m, 3H), 7.10 (t, 2H), 6.86 (s, 2H), 3.55 - 3.87 (m, 2H), 3.35 - 3.55 (m, 1H), 2.78 - 3.16 (m, 2H), 2.25 (m, 4H), 2.01 - 2.19 (m, 6H), 1.84 - 2.00 (m, 1H)
P18		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.60 (d, 1H), 7.89 - 8.22 (m, 3H), 6.88 (s, 2H), 3.50 - 3.84 (m, 2H), 3.26 - 3.47 (m, 1H), 2.78 - 3.05 (m, 4H), 2.27 (s, 4H), 1.97 - 2.13 (m, 6H), 1.79 - 1.97 (m, 1H), 1.55 (s, 2H), 1.20 (d, 2H), 0.78 (t, 3H)

P19		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.60 (d, 1H), 8.08 (d, 2H), 7.92 - 8.04 (m, 1H), 7.65 (dd, 2H), 7.04 (t, 2H), 6.75 (d, 2H), 3.49 - 3.80 (m, 2H), 3.26 - 3.44 (m, 1H), 2.71 - 2.97 (m, 2H), 2.25 (s, 4H), 1.90 (d, 7H)
P20		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.50 - 8.70 (m, 1H), 7.86 - 8.26 (m, 3H), 6.75 - 6.92 (m, 2H), 4.96 - 5.22 (m, 2H), 3.52 - 3.83 (m, 5H), 3.00 - 3.26 (m, 1H), 2.68 - 2.79 (m, 1H), 2.15 - 2.32 (m, 4H), 1.97 - 2.13 (m, 6H), 1.70 - 1.91 (m, 1H), 1.21 - 1.33 (m, 3H)
P21		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, en disolvente) δ ppm 1.68 - 1.97 (m, 4H), 2.13 - 2.35 (m, 6H), 2.70 - 2.91 (m, 1H), 2.97 - 3.13 (m, 1H), 3.23 (s, 2H), 3.29 - 3.42 (m, 4H), 3.42 - 3.82 (m, 3H), 7.33 (m, 3H), 7.55 - 7.65 (s, 1H), 7.76 - 7.96 (m, 2H), 8.19 (d, 2H), 8.56 (d, 1H)

P22		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.86 (d, 4H), 2.01 - 2.14 (m, 6H), 2.26 (s, 4H), 2.67 - 3.12 (m, 2H), 3.14 - 3.50 (m, 6H), 3.52 - 3.84 (m, 2H), 6.86 (s, 2H), 7.85 - 8.23 (m, 3H), 8.60 (d, 1H)
P23		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.49-8.40 (m, 1H), 8.24-8.12 (m, 2H), 7.50-7.39 (m, 1H), 6.88-6.76 (m, 2H), 3.84-3.49 (m, 2H), 3.33-3.13 (m, 1H), 2.93-2.69 (m, 2H), 2.25 (s, 4H), 2.04 (d, 6H), 1.95-1.76 (m, 1H), 1.09 (s, 9H)
P24		¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.60-8.49 (m, 1H), 8.34-8.12 (m, 2H), 7.90-7.73 (m, 1H), 7.49-7.36 (m, 1H), 6.83 (s, 2H), 3.87-3.51 (m, 2H), 3.36-3.15 (m, 1H), 2.96-2.62 (m, 2H), 2.25 (s, 4H), 2.04 (d, 6H), 1.94-1.79 (m, 1H), 1.08 (s, 9H)

P25		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.18-7.79 (m, 3H), 7.16-6.98 (m, 1H), 6.83 (s, 2H), 3.88-3.50 (m, 2H), 3.34-3.13 (m, 1H), 2.92-2.69 (m, 2H), 2.33-1.68 (m, 11H), 1.14-0.99 (m, 9H)
P26		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.56 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.29-8.22 (a, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.85 (t, 1H), 7.72-7.67 (m, 1H), 7.60 (s, 2H), 7.48-7.41 (m, 2H), 3.83-3.72 (m, 1H), 3.66-3.56 (m, 1H), 3.35-3.26 (m, 1H), 2.92-2.82 (m, 2H), 2.33-2.20 (m, 1H), 2.18 (d, 6H), 1.95-1.82 (m, 1H), 1.09 (s, 9H)
P27		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.54 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.22-8.15 (a, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.79 (t, 1H), 7.66-7.56 (m, 2H), 7.55 (s, 2H), 7.39-7.32 (m, 1H), 3.76-3.64 (m, 1H), 3.61-3.49 (m, 1H), 3.30-3.19 (m, 1H), 2.87-2.75 (m, 2H), 2.28-2.13 (m, 1H), 2.10 (d, 6H), 1.88-1.75 (m, 1H), 1.01 (s, 9H)

P28		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.56 (d, 1H), 8.26 (s a, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.86 (dt, 1H), 7.58 - 7.50 (m, 2H), 7.48 - 7.40 (m, 1H), 7.24 (d, 2H), 7.10 (t, 2H), 3.86 - 3.58 (m, 2H), 3.33 (dd, 1H), 2.96 - 2.83 (m, 2H), 2.53 - 2.38 (m, 2H), 2.30 (d, 1H), 2.14 (d, 2H), 1.90 (d, 1H), 1.14 - 1.04 (m, 12H)
P29		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.62 - 8.48 (m, 1H), 8.19 (d, 2H), 7.94 - 7.78 (m, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.49 - 7.39 (m, 1H), 7.32 (s, 2H), 3.86 - 3.68 (m, 1H), 3.68 - 3.51 (m, 1H), 3.43 - 3.25 (m, 1H), 2.97 - 2.72 (m, 2H), 2.34 (t, 3H), 2.15 (d, 6H), 1.97 - 1.75 (m, 1H), 1.66 - 1.45 (m, 2H), 0.84 (t, 3H)
P30		$^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.55 (d, 1H), 8.30-8.20 (m, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.07 (d, 1H), 3.82-3.69 (m, 1H), 3.68-3.57 (m, 1H), 3.29 (dd, 1H), 2.92-2.80 (m, 2H), 2.58-2.48 (m, 2H), 2.33-2.22 (m, 1H), 1.96-1.82 (m, 1H), 1.16 (t, 3H), 1.14 (s, 9H)

EJEMPLOS BIOLÓGICOS

Ejemplo biológico 1A

Prueba 1A - Ensayo de invernadero para determinar la actividad herbicida

- 5 Se sembraron semillas de una variedad de especies de prueba en tierra estándar en macetas. Tras cultivarlas durante un día (antes de la emergencia) o tras cultivarlas 8 días (después de la emergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizaron con una solución en spray acuosa derivada de la formulación del principio activo técnico en una solución de acetona/agua (50:50) que contenía un 0.5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxi-etileno, N.º de Reg. CAS 9005-64-5). Posteriormente, las plantas de prueba se cultivaron en condiciones controladas en un
- 10

invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se regaron dos veces al día. 13 días después de la aplicación del herbicida de prueba, antes y después de la emergencia, la prueba se evaluó visualmente para detectar la fitotoxicidad porcentual a la planta (donde un 100% = daño total a la planta; un 0% = ningún daño a la planta).

5 Ejemplo biológico 1A - Actividad herbicida posemergencia

Plantas de prueba:

Lolium perenne (LOLPE), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG) y *Avena fatua* (AVEFA); estas son todas malezas monocotiledóneas herbáceas.

Ejemplo biológico 1A - Tabla de la actividad herbicida posemergencia (% de fitotoxicidad)

N.º de compuesto	Tasa de aplicación (g/ha)	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A1	250	100	80	100	90
A2	250	100	90	80	80
A3	250	100	90	100	100
A4	250	80	70	100	60
A5	250	70	50	60	30
A6	250	90	30	90	60
A7	250	60	60	90	50
A8	250	90	60	80	70
A9	250	80	60	70	50
A10	250	70	60	50	70
A11	250	100	70	100	70
A12	250	100	80	100	100
A13	250	90	70	100	70
A14	250	70	60	100	70
A15	250	90	60	100	90
A16	250	60	60	50	50
A17	250	100	80	100	90
A18	250	90	60	100	80
A19	250	100	80	100	70
A20	250	100	70	100	70
A21	250	100	90	100	90
A22	250	80	70	80	80
A23	250	90	90	100	90
A24	250	90	80	80	80

ES 2 642 195 T3

A25	250	60	50	80	40
A26	250	80	80	80	80
A27	250	70	80	100	90
A28	250	70	100	80	50
A29	250	80	80	80	90
A32	250	100	90	100	100
A33	250	100	90	100	100
A34	250	100	90	100	100
A35	250	60	80	40	40
A36	250	80	80	80	70
A37	250	90	100	80	80
A38	250	100	100	100	100
A39	250	100	100	100	100
A40	250	100	100	100	100
A41	250	70	70	60	70
A43	250	100	100	100	100
A44	250	100	100	100	90
A45	250	80	50	60	80
A46	250	100	60	90	70
A47	250	100	80	100	90
A48	250	100	100	100	90
A50	250	100	20	70	70
A51	250	100	100	90	90
A52	250	90	70	100	70
A53	250	100	80	100	90
A54	250	100	100	60	100
A55	250	90	80	90	60
A56	250	100	100	90	90
A57	250	100	100	100	100
A57A	250	90	100	90	90
A58	250	80	50	50	30
A59	250	80	60	30	60
A60	250	80	80	70	90
A61	250	100	90	70	60
A62	250	100	100	80	80

ES 2 642 195 T3

A63	250	100	90	90	90
A64	250	80	90	60	80
A65	250	80	100	80	70
A66	250	60	80	70	40
A69	250	60	50	30	70
A70	250	100	100	90	90
A71	250	100	100	80	90
A72	250	90	90	70	90
A73	250	80	90	90	90
A74	250	80	90	70	30
A75	250	90	90	90	90
A76	250	60	70	80	90
A77	250	90	70	90	90
A78	250	60	80	80	80
A79	250	70	80	70	80
A83	250	100	100	100	100
A84	250	100	100	100	100
A85	250	100	90	100	100
A86	250	100	100	100	100
A87	250	100	100	100	100
A88	250	100	80	100	90
A89	250	100	100	100	100
A89A	250	100	100	100	100
A91	250	80	80	80	80
A92	250	70	80	70	80
A93	250	70	70	50	40
A94	250	80	90	90	100
A96	250	100	100	100	100
A97	250	100	100	100	100
A102	250	100	100	100	100
A104	250	100	90	100	90
A105 prueba 1	250	90	40	100	90
A105	250	90	60	100	90

ES 2 642 195 T3

prueba 2					
A106	250	100	90	100	100
A109	250	100	100	100	100
A110	250	100	90	100	100
A111	250	100	100	100	100
A114	250	100	100	100	100
A115	250	100	100	100	100
A116	250	100	90	100	100
A117	250	100	100	100	100
A118	250	100	100	100	100
A119	250	90	100	100	90
A120	250	100	100	100	90
A121	250	100	90	100	90
A122	250	100	100	100	90
A123	250	100	100	90	100
A124	250	100	100	100	100
A125	250	100	100	100	100
A126	250	100	100	100	100
A126A	250	90	90	90	90
A126B	250	90	90	100	90
A129	250	100	100	100	100
A130	250	80	30	80	80
A131	250	100	100	100	100
A132	250	100	100	100	100
A133	250	100	100	100	90
A134	250	100	100	100	100
A135	250	100	100	100	90
A136	250	100	100	100	90
A137	250	80	80	100	70
A138	250	100	100	100	90
A139	250	100	90	90	90
A140	250	100	90	100	100
A141	250	70	60	100	10
A141A	250	70	80	80	80

ES 2 642 195 T3

A142	250	100	100	100	90
A143	250	100	90	100	90
A144	250	90	30	100	90
A145	250	90	100	90	90
A146	250	70	60	100	40
A147	250	70	60	60	60
A148	250	90	70	90	90
A149	250	100	100	100	100
A150	250	80	70	80	90
A151	250	90	90	90	90
A152	250	70	80	80	70
A154	250	100	100	100	100
A155	250	100	100	100	100
A156	250	90	50	100	90
A157	250	70	70	90	70
A158	250	80	80	70	90
A159	250	100	100	90	90
A160	250	90	90	100	100
A161	250	100	90	100	100
A162	250	100	70	90	90
A164	250	90	90	100	100
A165	250	100	90	100	100
A166	250	90	80	60	90
A167	250	70	60	90	30
A168	250	70	60	80	80
A169	250				
A170 prueba 1	250	90	90	100	100
A170 prueba 2	250	80	90	100	90
A171	250	10	0	60	10
A172	250	100	90	100	90
A173 prueba 1	250	100	100	100	100
A173	250	100	100	100	100

ES 2 642 195 T3

prueba 2					
A174 prueba 1	250	100	90	90	100
A174 prueba 2	250	90	90	90	90
A177	250	90	100	100	90
A178	250	100	70	80	90
A179	250	70	70	80	100
A180	250	80	70	90	80
A181	250	90	80	80	100
A182	250	80	80	90	90
A183	250	90	60	90	60
A184	250	60	10	90	20
A185	250	100	90	100	100
A186	250	100	100	100	90
A187	250	100	90	100	90
A188	250	100	100	100	100
A189	250	100	100	100	100
A190	250	90	80	90	90
A191	250	90	100	100	100
A192	250	100	80	100	90
A193	250	100	90	90	90
A194	250	90	80	100	90
A195	250	60	30	80	30
A196	250	90	80	100	90
A197	250	60	90	100	70
A203	250	80	80	100	100
A204	250	100	90	100	90
A212	250	70	30	70	50
A213	250	60	10	50	10
P2	250	90	80	100	100
P3	250	100	90	100	100
P4	250	100	100	100	100
P6	250	100	100	100	100

P7	250	100	100	100	100
P8	250	100	100	100	100
P9	250	100	100	100	100
P10	250	100	100	100	100
P11	250	100	100	100	100
P12	250	100	100	100	100
P13	250	100	100	100	100
P14	250	100	100	100	100
P15	250	100	100	100	100
P16	250	100	100	100	90
P17	250	100	100	100	100
P18	250	100	100	100	90
P19	250	100	100	100	100
P20	250	100	100	100	100
P21	250	70	80	100	80
P22	250	100	90	100	100
N.º de compuesto	Tasa de aplicación (g/ha)	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA

Nota: un guión (-) en la tabla anterior indica que no se realizó ninguna medición.

Ejemplo biológico 1A - Actividad herbicida preemergencia

5 Plantas de prueba: *Lolium perenne* (LOLPE), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG) y *Avena fatua* (AVEFA); estas son todas malezas monocotiledóneas herbáceas.

Ejemplo biológico 1A - Tabla de la actividad herbicida preemergencia (% de fitotoxicidad)

Se obtuvieron resultados herbicidas preemergencia positivos para muchos compuestos ilustrativos de la presente invención aplicados preemergencia con una tasa de 250 g/ha, pero, por motivos de brevedad, a continuación se presentan únicamente algunos de estos resultados.

N.º de compuesto	Tasa de aplicación (g/ha)	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A1	1000	100	90	100	70
A2	250	100	90	70	70
A3	250	100	90	100	90
A13	250	90	80	100	80

A19	250	100	90	100	50
A23	250	100	90	100	80
A32	250	100	100	100	80
A33	250	100	90	100	80
A34	250	100	90	100	100
A87	250	100	100	100	90
A89	250	100	100	100	100
A120	250	100	90	100	70
A145	250	100	90	90	40
A159	250	100	90	100	80
P8	250	100	90	100	90
P9	250	100	100	100	90

Ejemplo biológico 1B**Prueba 1B - Ensayo de invernadero para determinar la actividad herbicida posemergencia contra malezas monocotiledóneas herbáceas y cultivos de cereales (trigo y cebada)**

5 Los Ejemplos biológicos 1B evalúan la actividad herbicida de compuestos "técnicos" (es decir, compuestos sin formular previamente antes de la prueba), como herbicidas objeto de estudio.

Se prepara una "formulación de la presente", conocida como "IF50" que contiene 50 g/litro (es decir, 5% p/v) del principio activo (es decir, el herbicida objeto de estudio) "técnico" (es decir, sin formular) disolviendo el principio activo en una mezcla de disolventes orgánicos y emulsionante, cuyos detalles se proporcionan en la Tabla siguiente.

10 *Tabla:* Composición de la mezcla de disolventes orgánicos y emulsionante utilizados como base para la formulación de la presente (IF50).

Componente	Proveedor	Descripción química	Número de registro CAS	Cantidad/%p/p
Emulsogen EL360 TM	Clariant	etoxilato de aceite de ricino (como emulsionante)	61791-12-6	11.12
N-metil-pirrolidona	extensa disponibilidad	1-metil-2-pirrolidona	872-50-4	44.44
Éter glicólico Dowanol DPM TM	Dow	éter dipropilen-glicol monometílico	34590-94-8	44.44

15 Esta IF50 se mezcla con una pequeña cantidad variable de acetona para facilitar la disolución, antes de añadir una solución acuosa al 0.5% v/v del adyuvante AdigorTM (un adyuvante que contiene éster metílico de aceite de colza, alcoholes etoxilados y una mezcla de hidrocarburos aromáticos de alto peso molecular, p. ej., comercializada por Syngenta), como diluyente acuoso, para formar una solución en espray acuosa que contiene una concentración predeterminada del principio activo (que varía dependiendo de la tasa de aplicación del principio activo a las plantas) y un 0.5% v/v del adyuvante AdigorTM. Esta solución en espray acuosa es adecuada para pulverizarla sobre plantas.

20 Se siembran semillas de una variedad de especies de prueba en tierra estándar en macetas. Tras cultivar durante 14 días en condiciones controladas en un invernadero (a 22/16 °C, día/noche; 16 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizan después de la emergencia con la solución en espray acuosa mencionada anteriormente que contiene *inter alia* el principio activo "técnico" (es decir, el herbicida objeto de estudio) y el adyuvante AdigorTM.

25 Posteriormente, las plantas de prueba se cultivan en condiciones controladas en el invernadero (a 22/16 °C, día/noche; 16 horas de luz; 65% de humedad) y se riegan dos veces al día. 14 días después de la aplicación del herbicida de prueba, la prueba se evalúa visualmente para detectar la fitotoxicidad porcentual a la planta (donde un 100% = daño total a la planta; un 0% = ningún daño a la planta).

Más específicamente, los datos de la actividad herbicida posemergencia (fitotoxicidad), sobre ciertas malezas monocotiledóneas herbáceas (y/o plantas del tipo de las gramíneas) y cultivos de cereales evaluados en el invernadero, se midieron 14 días después de la aplicación del herbicida (14 DAA), normalmente para, *inter alia*, una o más de las siguientes tasas de aplicación:

- 5 (a) una tasa de aplicación posemergencia de 60 g/ha del herbicida de prueba con o sin 50 g/ha del protector cloquintocet-mexilo y
- (b) una tasa de aplicación posemergencia de 90 g/ha del herbicida de prueba con 50 g/ha del protector cloquintocet-mexilo y
- 10 (c) una tasa de aplicación posemergencia de 120 g/ha del herbicida de prueba con 50 g/ha del protector cloquintocet-mexilo.

El cloquintocet-mexilo, cuando se utiliza, está presente en la formulación que contiene el herbicida objeto de estudio disuelto en acetona junto con IF50.

El rango de las tasas de aplicación del herbicida evaluado a veces incluye tasas de aplicación diferentes de las que se muestran anteriormente y las tasas pueden variar dependiendo del herbicida objeto de estudio.

- 15 La actividad herbicida (fitotoxicidad) se evalúa visualmente y se otorga un puntaje de fitotoxicidad porcentual evaluado para cada aplicación de herbicida en cada especie de planta (con un 100% = daño total sobre la planta; un 0% = ningún daño sobre la planta; la evaluación se registra en incrementos de un 1%). Se realizan dos replicados para cada experimento y se registran los datos de la actividad herbicida media (fitotoxicidad).

- 20 A continuación, se muestra una selección de los resultados obtenidos en el Ejemplo biológico 1B, utilizando sustancialmente el método de prueba descrito anteriormente, para los compuestos A34, A98, A99, A87, A100, A101, A89, A120, A120A, A120B, A23, A127, A128, A89, A112 y A113.

- 25 Para los compuestos A34, A98, A99, A87, A100, A101, A89, A120, A120A, A120B, A23, A127, A128, A89, A112 y A113, las malezas evaluadas fueron las siguientes: *Avena fatua* (AVEFA), *Lolium multiflorum* (LOLMU), *Setaria viridis* (SETVI), *Poa annua* (POAAN), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY). Estas cinco malezas son todas ellas malezas monocotiledóneas herbáceas. Salvo SETVI, todas ellas son malezas monocotiledóneas herbáceas de "estaciones frías".

Ejemplo biológico 1B - Actividad herbicida posemergencia contra malezas herbáceas - Resultados (fitotoxicidad porcentual)

Abreviaturas: T1 = resultado n.º 1 de la prueba herbicida, para cada uno de los compuestos A98 y A99.

- 30 T2 = resultado n.º 2 de la prueba herbicida, para cada uno de los compuestos A98 y A99.

Número de compuesto (herbicida)	Tasa de aplicación de herbicida (g/ha)	Tasa de aplicación de cloquintocet-mexilo (g/ha)	AVEFA	LOLMU	SETVI	POAAN	ALOMY
A34	60	0	100	83	80	78	65
A34	60	50	100	90	85	75	73
A98	60	0	100 (T1)	95 (T1)	94 (T1)	78 (T1)	80 (T1)
A98	60	50	100 (T1); 100 (T2)	95 (T1); 100 (T2)	97 (T1); 100 (T2)	75 (T1); 75 (T2)	80 (T1); 78 (T2)
A98	90	50	100 (T2)	100 (T2)	100 (T2)	78 (T2)	88 (T2)
A98	120	50	100 (T2)	100 (T2)	100 (T2)	83 (T2)	97 (T2)
A99	60	0	50 (T1)	35 (T1)	10 (T1)	70 (T1)	50 (T1)

ES 2 642 195 T3

A99	60	50	40 (T1); 48 (T2)	35 (T1); 55 (T2)	8 (T1); 33 (T2)	73 (T1); 70 (T2)	35 (T1); 38 (T2)
A99	90	50	60 (T2)	65 (T2)	68 (T2)	73 (T2)	58 (T2)
A99	120	50	78 (T2)	78 (T2)	75 (T2)	75 (T2)	73 (T2)
A87	60	0	100	100	93	83	97
A87	60	50	100	100	95	83	95
A87	30	50	100	100	73	75	70
A100	60	0	100	100	99	80	83
A100	60	50	100	100	99	78	78
A100	45	50	100	100	99	78	75
A100	30	50	100	100	95	73	55
A101	60	0	90	88	53	48	55
A101	60	50	88	83	53	38	55
A101	45	50	88	83	35	15	43
A101	30	50	73	68	15	5	25
A89	60	0	90	100	100	25	98
A89	60	50	90	100	100	15	98
A89	45	50	85	99	100	3	97
A89	30	50	83	90	100	0	88

Número de compuesto (herbicida)	Tasa de aplicación de herbicida (g/ha)	Tasa de aplicación de cloquintocet-mexilo (g/ha)	AVEFA	LOLMU	SETVI	POAAN	ALOMY
A120	60	0	85	100	100	10	85
A120	60	50	78	99	100	3	80
A120	45	50	78	99	100	3	80
A120	30	50	75	98	100	3	75
A120A	60	0	97	100	100	30	95
A120A	60	50	97	100	100	10	90
A120A	45	50	95	100	100	5	88
A120A	30	50	90	97	100	3	80
A120B	60	0	38	83	68	4	73
A120B	60	50	48	73	68	4	70
A120B	45	50	10	73	65	0	58

ES 2 642 195 T3

A120B	30	50	3	58	40	0	43
A23	60	0	80	90	99	0	75
A23	60	50	70	83	99	0	78
A23	30	50	13	48	95	0	28
A127	60	0	85	97	100	0	78
A127	60	50	90	83	100	0	68
A127	45	50	80	83	99	0	63
A127	30	50	55	65	97	0	48
A128	60	0	18	85	55	5	48
A128	60	50	10	78	63	0	35
A128	45	50	3	63	43	0	25
A128	30	50	0	43	23	0	3
A89	60	0	97	100	99	15	99
A89	60	50	93	95	100	3	98
A89	30	50	85	93	95	0	80
A112	60	0	98	100	100	40	99
A112	60	50	97	100	100	13	98
A112	45	50	94	100	100	0	97
A112	30	50	93	98	100	0	97
A113	60	0	5	45	53	8	20
A113	60	50	3	23	55	0	25
A113	45	50	3	20	40	0	18
A113	30	50	1	3	5	0	0

Ejemplo biológico 1B - Actividad herbicida posemergencia contra cultivos de cereales (trigo y cebada) - Resultados (fitotoxicidad porcentual)

Abreviaturas: T1 = resultado n.º 1 de la prueba herbicida, para cada uno de los compuestos A98 y A99.

5 T2 = resultado n.º 2 de la prueba herbicida, para cada uno de los compuestos A98 y A99.

Número de compuesto (herbicida)	Tasa de aplicación de herbicida (g/ha)	Tasa de aplicación de clo-quin-tocet-mexilo (g/ha)	Trigo de invierno "Hereward"	Trigo de primavera "Teal"	Cebada de primavera "Harrington"	Cebada de invierno "Suzuka"
A34	60	0	20	43	83	83
A34	60	50	5	10	33	38

ES 2 642 195 T3

A98	60	0	35 (T1)	30 (T1)	33 (T1)	75 (T1)
A98	60	50	13 (T1); 9 (T2)	10 (T1); 5 (T2)	10 (T1); 4 (T2)	13 (T1); 8 (T2)
A98	90	50	13 (T2)	13 (T2)	5 (T2)	9 (T2)
A98	120	50	23 (T2)	20 (T2)	15 (T2)	40 (T2)
A99	60	0	0 (T1)	2 (T1)	15 (T1)	60 (T1)
A99	60	50	1 (T1); 0 (T2)	1 (T1); 5 (T2)	3 (T1); 3 (T2)	15 (T1); 14 (T2)
A99	90	50	0 (T2)	5 (T2)	5 (T2)	35 (T2)
A99	120	50	8 (T2)	8 (T2)	8 (T2)	38 (T2)
A87	60	0	43	48	73	83
A87	60	50	33	38	60	60
A87	30	50	23	18	0	3
A100	60	0	60	65	83	93
A100	60	50	40	45	28	53
A100	45	50	30	30	18	30
A100	30	50	15	20	13	10
A101	60	0	43	48	48	75
A101	60	50	38	18	23	40
A101	45	50	23	13	18	23
A101	30	50	18	10	18	23
A89	60	0	60	75	95	95
A89	60	50	28	50	85	73
A89	45	50	25	20	55	20
A89	30	50	15	13	13	8

Número de compuesto (herbicida)	Tasa de aplicación de herbicida (g/ha)	Tasa de aplicación de cloquin-tocet-mexilo (g/ha)	Trigo de invierno "Hereward"	Trigo de primavera "Freya"	Cebada de primavera "Harrington"	Cebada de invierno "Suzuka"
A120	60	0	68	55	78	88
A120	60	50	50	30	38	40
A120	45	50	50	30	38	40
A120	30	50	38	18	25	15
A120A	60	0	73	NE	85	93

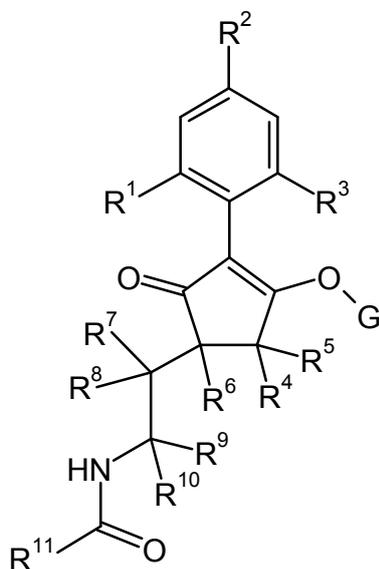
ES 2 642 195 T3

A120A	60	50	65	NE	73	83
A120A	45	50	60	NE	60	75
A120A	30	50	53	NE	30	23
A120B	60	0	58	NE	53	75
A120B	60	50	13	NE	23	13
A120B	45	50	10	NE	10	9
A120B	30	50	7	NE	3	3
A23	60	0	68	63	75	70
A23	60	50	0	7	5	15
A23	30	50	0	5	1	0
A127	60	0	65	70	83	85
A127	60	50	5	5	8	5
A127	45	50	0	3	0	0
A127	30	50	0	0	0	0
A128	60	0	8	7	48	18
A128	60	50	0	3	0	0
A128	45	50	0	0	0	0
A128	30	50	0	3	0	0
A89	60	0	75	70	88	90
A89	60	50	25	38	43	25
A89	30	50	10	13	13	8
A112	60	0	85	75	93	88
A112	60	50	50	50	73	53
A112	45	50	40	33	45	30
A112	30	50	33	25	30	18
A113	60	0	3	7	33	28
A113	60	50	0	0	8	0
A113	45	50	0	0	0	0
A113	30	50	0	3	0	0

NE = No evaluado

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



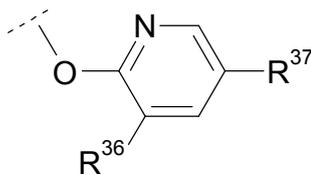
donde:

5 R^1 es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o fluorometoxi;

R^2 es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo, fluoroetilo, vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo, 2-(ciclopropil)etinilo, halógeno, metoxi, prop-2-inilo o (fluoroalquil C₁-C₂)metoxi-;

10 o R^2 es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;

o R^2 es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;



o R^2 es , en donde R^{36} es flúor o cloro, y R^{37} es flúor, cloro o fluoroalquilo C₁; y

15 R^3 es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, isopropoxi, fluoroalcoxi C₁-C₂, (alcoxi C₁-C₂)-(alcoxi C₁-C₃)- o (fluoroalcoxi C₁)-(alcoxi C₁-C₃)-;

R^4 , R^5 y R^6 son, independientemente unos de otros, hidrógeno, alquilo C₁-C₅, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, fluoroalquilo C₁-C₂ o (alcoxi C₁-C₂)-(alquilo C₁-C₂);

siempre que: (i) al menos dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean hidrógeno, o (ii) dos de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sean metilo y el restante de los grupos R^4 , R^5 y R^6 sea hidrógeno; y

20 R^7 y R^8 son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, flúor o alquilo C₁-C₃; y

R^9 y R^{10} son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, flúor o alquilo C₁-C₃;

siempre que no más de dos de los grupos R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} sean flúor;

y siempre que al menos dos de los grupos R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} sean hidrógeno;

y donde

25 R^{11} es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, tetrahidro-2*H*-piranilo, tetrahidrofuranilo, oxetanilo, tetrahidrotiofenilo o tietanilo;

o R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico, el cual está unido mediante carbono (es decir, unido mediante un carbono anular) y el cual es piridinilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo o 1,2,4-triazinilo, donde el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes;

5 donde dichos 1, 2 o 3 sustituyentes opcionales en el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico son independientemente flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciclopropilo, (alcoxi C_{n1})(alquilo C_{n2}) (donde n1 es 1 o 2, n2 es 1 o 2 y n1+n2 es 2 o 3), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃, fluoroetinilo, ciano, amino o fenilo donde el fenilo está opcionalmente sustituido en su posición o posiciones meta y/o para con 1 o 2 átomos de flúor; y

10 donde, cuando R¹¹ es pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo o 1,2,4-triazinilo, entonces cada uno de ellos está opcionalmente sustituido con 1 o 2 de los sustituyentes en el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico, según se definen en la presente;

donde, cuando R¹¹ es piridin-3-ilo o piridin-4-ilo, entonces cada uno de ellos está sustituido con 1 o 2 de los sustituyentes en el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico, según se definen en la presente,

15 donde, cuando R¹¹ es piridin-2-ilo sustituido con 3 sustituyentes, entonces uno o más de los sustituyentes opcionales en el piridin-2-ilo es o son flúor;

donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con alquilo C₂, fluoroalquilo C₂, alcoxi C₂ o fluoroalcoxi C₂, entonces: el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico está sustituido con 1 o 2 sustituyentes que son independientemente alquilo C₂, fluoroalquilo C₂, alcoxi C₂ o fluoroalcoxi C₂, y el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico está opcionalmente sustituido además con 1 o 2 sustituyentes que son independientemente flúor, cloro, bromo, alquilo C₁, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁, fluoroalcoxi C₁ o ciano; siempre que el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico no esté sustituido con más de 2 sustituyentes o, en el caso de un piridin-2-ilo, no esté sustituido con más de 3 sustituyentes;

20

donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con yodo, alquilo C₃, fluoroalquilo C₃, ciclopropilo, (alcoxi C_{n1})(alquilo C_{n2}), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃ o fluoroetinilo, entonces: el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es piridin-2-ilo sustituido con un solo yodo, alquilo C₃, fluoroalquilo C₃, ciclopropilo, (alcoxi C_{n1})(alquilo C_{n2}), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃ o fluoroetinilo, y donde el anillo de piridin-2-ilo está opcionalmente sustituido además con 1 o 2 átomos de flúor;

25

donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con amino, entonces: o bien el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es 6-aminopiridin-2-ilo opcionalmente sustituido además con 1 o 2 átomos de flúor; o el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es 3-aminopiridin-2-ilo o 3-aminopirazin-2-ilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido además en la posición 5 del anillo de piridin-2-ilo o pirazin-2-ilo con hidrógeno, flúor, metilo o fluoroalquilo C₁; y

30

donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico sustituido con fenilo opcionalmente sustituido, entonces el heteroarilo que es un anillo de 6 miembros monocíclico es 6-fenilpiridin-2-ilo donde el fenilo está opcionalmente sustituido en su posición o posiciones meta y/o para con 1 o 2 átomos de flúor, y donde el anillo de piridin-2-ilo está opcionalmente sustituido además con 1 o 2 átomos de flúor;

35

o R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico, el cual está unido mediante carbono (es decir, unido mediante un carbono anular) y el cual es pirrolilo, pirazolilo, imidazol-2-ilo, triazolilo, tetrazolilo, furilo, tiofenilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxadiazolilo o tiadiazolilo, donde el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes;

40

donde dichos 1, 2 o 3 sustituyentes opcionales en el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico son:

1, 2 o 3 sustituyentes opcionales de un carbono anular que son independientemente flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciclopropilo, (alcoxi C_{n3})(alquilo C_{n4}) (donde n3 es 1 o 2, n4 es 1 o 2 y n3+n4 es 2 o 3), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃, fluoroetinilo o ciano; y/o

45

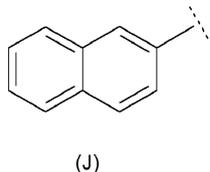
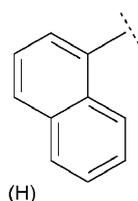
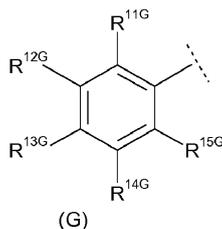
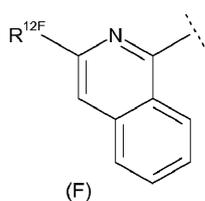
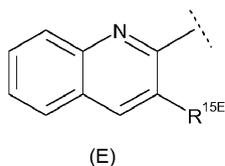
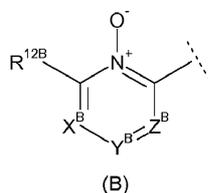
1 sustituyente que es alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃ o ciclopropilo, sustituido en un nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace, donde el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico tiene un nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace;

siempre que el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tenga más de 3 sustituyentes o no tenga más del número máximo de sustituyentes posibles para el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico en forma no cargada si este máximo es inferior a 3 sustituyentes; y

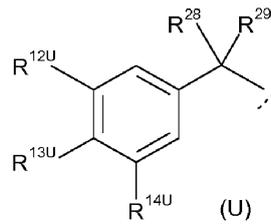
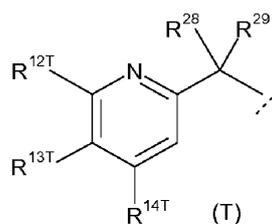
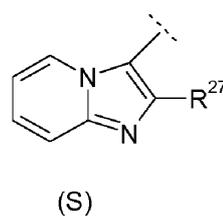
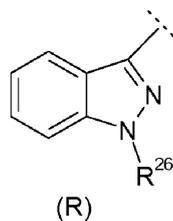
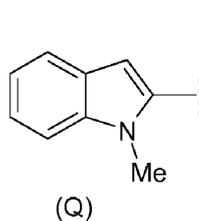
5 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico que tiene un nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace, entonces el nitrógeno anular que no forma parte de un doble enlace está sustituido con alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃ o ciclopropilo; y

10 donde, cuando R¹¹ es un heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico, entonces: el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tiene más de un sustituyente de tipo fluoroalquilo C₃, vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃ o fluoroetenilo; el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tiene más de 2 sustituyentes que son independientemente bromo, alquilo C₂-C₃, fluoroalquilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciclopropilo, (alcoxi C_{n3})(alquilo C_{n4}), vinilo, fluoroalquenilo C₂, alquinilo C₂-C₃, fluoroetenilo o ciano; y el heteroarilo que es un anillo de 5 miembros monocíclico no tiene más de 2 sustituyentes que son independientemente cloro o bromo;

o R¹¹ es una de las siguientes subfórmulas B, E, F, G, H, J, Q, R, S, T o U:



15



donde:

X^B es nitrógeno o CR^{13B};

Y^B es nitrógeno o CR^{14B};

Z^B es nitrógeno o CR^{15B} ;

siempre que no más de uno de los grupos X^B , Y^B y Z^B sea nitrógeno; y

R^{12B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 , ciano, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;

5 R^{14B} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{15B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12B} , R^{13B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{13B} sea bromo, entonces X^A sea CR^{13B} , y R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno; y

10 R^{15E} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{12F} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{11G} es hidrógeno, flúor, metilo o fluoroalquilo C_1 ;

R^{12G} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{13G} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;

15 R^{14G} es hidrógeno o flúor;

R^{15G} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;

siempre que, cuando R^{13G} sea bromo, entonces R^{11G} , R^{12G} , R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor;

siempre que, cuando R^{11G} sea metilo o fluoroalquilo C_1 , entonces R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor; y

20 siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean hidrógeno; y

R^{26} es hidrógeno o metilo;

R^{27} es hidrógeno o metilo;

R^{28} y R^{29} son independientemente hidrógeno o flúor;

25 R^{12T} , R^{13T} y R^{14T} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12T} , R^{13T} y R^{14T} sean hidrógeno; y

R^{12U} , R^{13U} y R^{14U} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12U} , R^{13U} y R^{14U} sean hidrógeno;

y donde:

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

30 G es $-C(X^a)-R^a$, $-C(X^b)-X^c-R^b$, $-C(X^d)-N(R^c)-R^d$, $-SO_2-R^e$, $-P(X^e)(R^f)-R^g$, $-CH_2-X^f-R^h$, o $-CH(Me)-X^f-R^h$; o fenil- CH_2- o fenil- CH (alquil C_1-C_2)- (en cada uno de los cuales el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1-C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o heteroaril- CH_2- o heteroaril- CH (alquil C_1-C_2)- (en cada uno de los cuales el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1-C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o fenil- $C(O)-CH_2-$ (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1-C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1-C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro); o (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)-CH_2-$, (alquil C_1-C_6)- $C(O)-CH_2-$, (alcoxi C_1-C_6)- $C(O)-CH=CH-$, (alquen C_2-C_7)-1-il- CH_2- , (alquen C_2-C_7)-1-il- CH (alquil C_1-C_2)-, (fluoroalquen C_2-C_4)-1-il- CH_2- , (alquin C_2-C_7)-1-il- CH_2- o (alquin C_2-C_7)-1-il- CH (alquil C_1-C_2)-;

donde X^a , X^b , X^c , X^d , X^e y X^f son independientemente unos de otros oxígeno o azufre; y donde

40 R^a es H, alquilo C_1-C_{21} , alqueno C_2-C_{21} , alquino C_2-C_{18} , fluoroalquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_1-C_{10} , nitroalquilo C_1-C_{10} , aminoalquilo C_1-C_{10} , (alquilamino C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (dialquilamino C_2-C_8)-(alquilo C_1-C_5), (cicloalquil C_3-C_7)-(alquilo C_1-C_5), (alcoxi C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (alquenoiloxi C_3-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (alquinoiloxi C_3-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (alquiltio C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (alquilsulfinil C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (alquilsulfonil C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_5), (alquildenaminoxil C_2-C_8)-(alquilo C_1-C_5), (alquil C_1-C_5)carbonil-(alquilo C_1-C_5), (alcoxi C_1-C_5)carbonil-(alquilo C_1-C_5),

- independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;
- 5 fenilamino o fenilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; difenilamino o difenilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o cicloalquilamino C₃-C₇, di(cicloalquil C₃-C₇)amino, cicloalcoxi C₃-C₇, alcoxi C₁-C₁₀, fluoroalcoxi C₁-C₁₀, alquilamino C₁-C₅ o di(alquil C₁-C₄)amino;
- 10 R^f y R^g son cada uno independientemente uno del otro alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, fluoroalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, (alquilamino C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)-(alquilo C₁-C₅), (cicloalquil C₃-C₇)-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alqueniloxi C₃-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquiniloxi C₃-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilideno C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfinil C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfonyl C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilidenaminoxil C₂-C₈)-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), aminocarbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquilamino C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonilamino-(alquilo C₁-C₅), N-(alquil C₁-C₅)carbonil-N-(alquilamino C₂-C₅)alquilo, (trialquilsilil C₃-C₆)-(alquilo C₁-C₅), fenilalquilo C₁-C₅ (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonyl C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonyl C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; fenilamino o fenilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; difenilamino o difenilamino sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o cicloalquilamino C₃-C₇, di(cicloalquil C₃-C₇)amino, cicloalcoxi C₃-C₇, fluoroalcoxi C₁-C₁₀, alquilamino C₁-C₅ o di(alquil C₁-C₄)amino; o benciloxi o fenoxi, donde los grupos bencilo y fenilo están a su vez opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y
- 35 R^h es alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₃-C₁₀, alquinilo C₃-C₁₀, fluoroalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, (alquilamino C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)-(alquilo C₁-C₅), (cicloalquil C₃-C₇)-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alqueniloxi C₃-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquiniloxi C₃-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilideno C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfinil C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilsulfonyl C₁-C₅)-(alquilo C₁-C₅), (alquilidenaminoxil C₂-C₈)-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alcoxi C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), aminocarbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquilamino C₁-C₅)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (dialquilamino C₂-C₈)carbonil-(alquilo C₁-C₅), (alquil C₁-C₅)carbonilamino-(alquilo C₁-C₅), N-(alquil C₁-C₅)carbonil-N-(alquilamino C₂-C₅)alquilo, (trialquilsilil C₃-C₆)-(alquilo C₁-C₅), fenil(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonyl C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonyl C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroariloxi-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonyl C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; (alquil C₁-C₆)-C(O)-; (alcoxi C₁-C₆)-C(O)-; o fenil-C(O)- donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro;

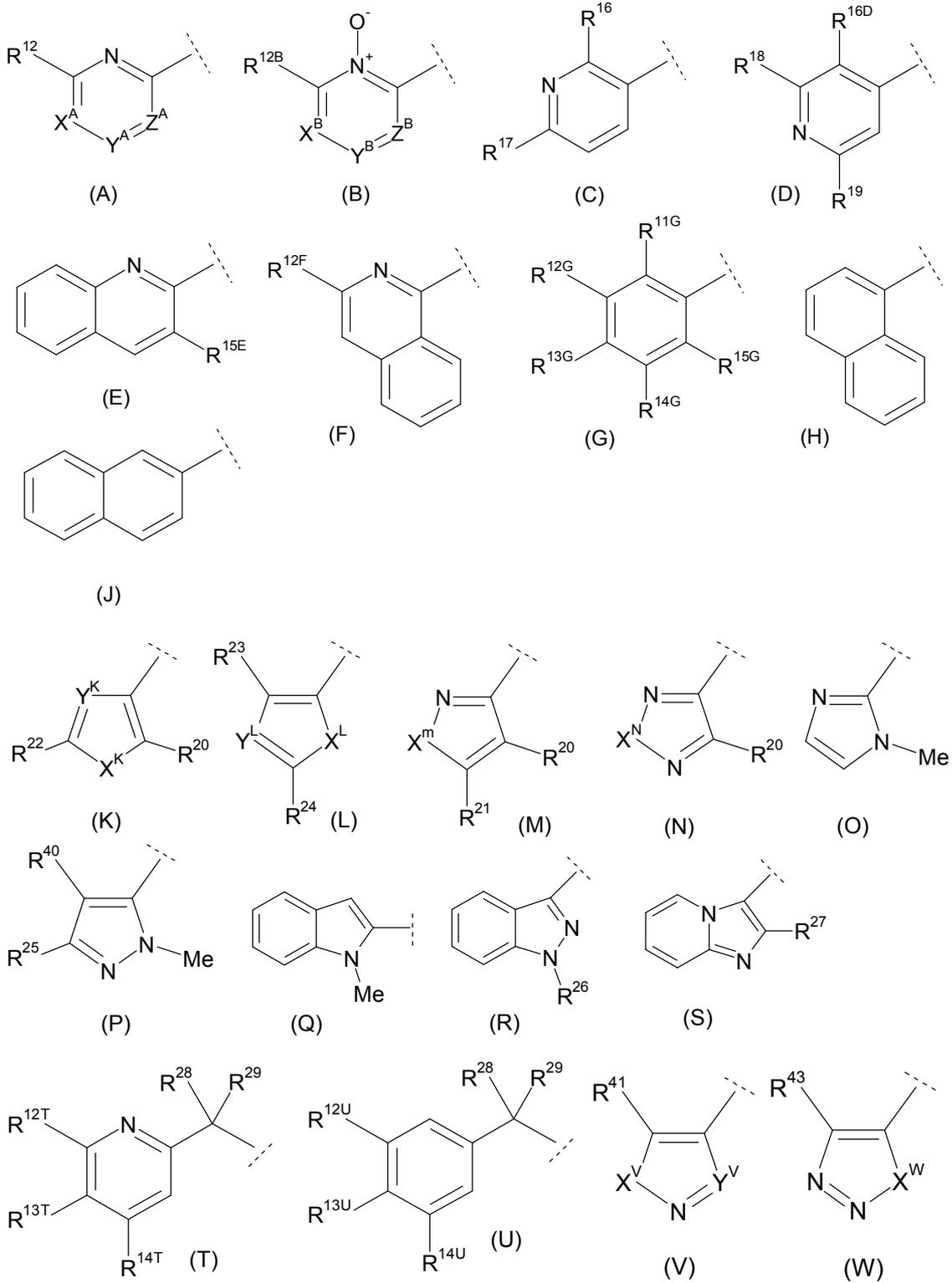
donde el término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo anular y está constituido por un único anillo o por dos anillos condensados;

60 y donde el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

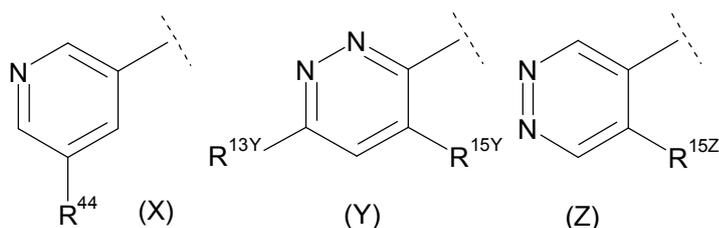
2. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 1, donde:

R¹¹ es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, tetrahidro-2*H*-piranilo, tetrahydrofuranilo, oxetanilo, tetrahidrotiofenilo o tietanilo;

o R¹¹ es una de las siguientes subfórmulas A, B, C, D, E, F, G, H, J, K, L, M, N, O, P, Q, R, S, T, U, V, W, X, Y o Z:



5



donde:

X^A es nitrógeno o CR^{13} ;

Y^A es nitrógeno o CR^{14} ;

5 Z^A es nitrógeno o CR^{15} ;

siempre que no más de uno de los grupos X^A , Y^A y Z^A sea nitrógeno; y

R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 - C_2 , alcoxi C_1 - C_2 , fluoroalcoxi C_1 - C_2 , ciano, amino o fenilo opcionalmente sustituido en una o más de las posiciones *meta* y/o *para* con 1 o 2 sustituyentes flúor;

10 R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, fluoroalquilo C_1 , fluoroalquilo C_2 , vinilo, fluoroalqueno C_2 , alquino C_2 - C_3 , fluoroetino, ciano, metoxi, etoxi, fluoroalcoxi C_1 o fluoroalcoxi C_2 ;

R^{14} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano;

R^{15} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 , metoxi, fluoroalcoxi C_1 , ciano o amino;

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

15 y siempre que, cuando R^{12} sea yodo, amino o fenilo opcionalmente sustituido, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{13} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{13} sea bromo, entonces X^A sea CR^{13} , y R^{12} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

20 y siempre que, cuando R^{13} sea etilo, fluoroalquilo C_2 , vinilo, fluoroalqueno C_2 , alqueno C_2 - C_3 , fluoroetino, etoxi o fluoroalcoxi C_2 , entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{12} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{14} sea bromo o ciano, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{12} , R^{13} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12} , R^{13} y R^{15} sean hidrógeno;

25 y siempre que, cuando R^{15} sea amino, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea nitrógeno o CR^{14} ,

Z^A es CR^{15} , y R^{13} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 , y R^{12} y R^{14} son hidrógeno;

y donde:

X^B es nitrógeno o CR^{13B} ;

Y^B es nitrógeno o CR^{14B} ;

30 Z^B es nitrógeno o CR^{15B} ;

siempre que no más de uno de los grupos X^B , Y^B y Z^B sea nitrógeno; y

R^{12B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

R^{13B} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 , ciano, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;

R^{14B} es hidrógeno, flúor o cloro;

35 R^{15B} es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12B} , R^{13B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{13B} sea bromo, entonces X^A sea CR^{13B} , y R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12B} , R^{14B} y R^{15B} sean hidrógeno; y

R^{16} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o fluoroalquilo C_1 ;

R^{17} es hidrógeno, flúor, cloro, metilo o fluoroalquilo C_1 ;

5 siempre que no más de uno de los grupos R^{16} y R^{17} sea hidrógeno;

y siempre que cuando R^{16} sea bromo entonces R^{17} sea hidrógeno o flúor;

R^{16D} es hidrógeno o flúor;

R^{18} es hidrógeno, flúor o cloro;

10 R^{19} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo o fluoroalquilo C_1 ;

siempre que no más de uno de los grupos R^{18} y R^{19} sea hidrógeno;

R^{15E} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{12F} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{11G} es hidrógeno, flúor, metilo o fluoroalquilo C_1 ;

15 R^{12G} es hidrógeno, flúor o cloro;

R^{13G} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;

R^{14G} es hidrógeno o flúor;

R^{15G} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;

siempre que, cuando R^{13G} sea bromo, entonces R^{11G} , R^{12G} , R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor;

20 siempre que, cuando R^{11G} sea metilo o fluoroalquilo C_1 , entonces R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean independientemente hidrógeno o flúor; y

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean hidrógeno;

X^K es O o S; e Y^K es C-H o N;

X^L es O, S o N-Me; e Y^L es C-H o N; siempre que cuando X^L sea N-Me entonces Y^L no sea N;

25 X^m es O, S o N-Me;

X^N es O, S o N-Me;

X^V es O, S o N-Me; e Y^V es N o CR^{42} ; y

X^W es O, S o N-Me;

R^{20} es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C_1 , flúor o cloro;

30 R^{21} es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C_1 , etilo, ciclopropilo, flúor o cloro;

R^{22} es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C_1 , flúor o cloro;

R^{23} es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C_1 , etilo o ciclopropilo;

R^{24} es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C_1 , etilo o metoximetilo;

R^{25} es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C_1 , flúor o cloro;

35 R^{26} es hidrógeno o metilo; y

R^{27} es hidrógeno o metilo; y

R^{28} y R^{29} son independientemente hidrógeno o flúor;

R⁴⁰ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro;

R⁴¹ es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro;

R⁴² es hidrógeno, metilo, fluoroalquilo C₁, flúor o cloro;

R⁴³ es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C₁;

5 R⁴⁴ es flúor, cloro o bromo;

R^{12T}, R^{13T} y R^{14T} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12T}, R^{13T} y R^{14T} sean hidrógeno; y

R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12U}, R^{13U} y R^{14U} sean hidrógeno;

10 R^{13Y} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, fluoroalquilo C₁, metoxi o fluoroalcoxi C₁;

R^{15Y} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metoxi o fluoroalcoxi C₁;

siempre que uno o ambos grupos R^{13Y} y R^{15Y} sean independientemente hidrógeno o flúor; y

R^{15Z} es hidrógeno, flúor o cloro; y

15 y donde el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

3. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 1 o 2, donde:

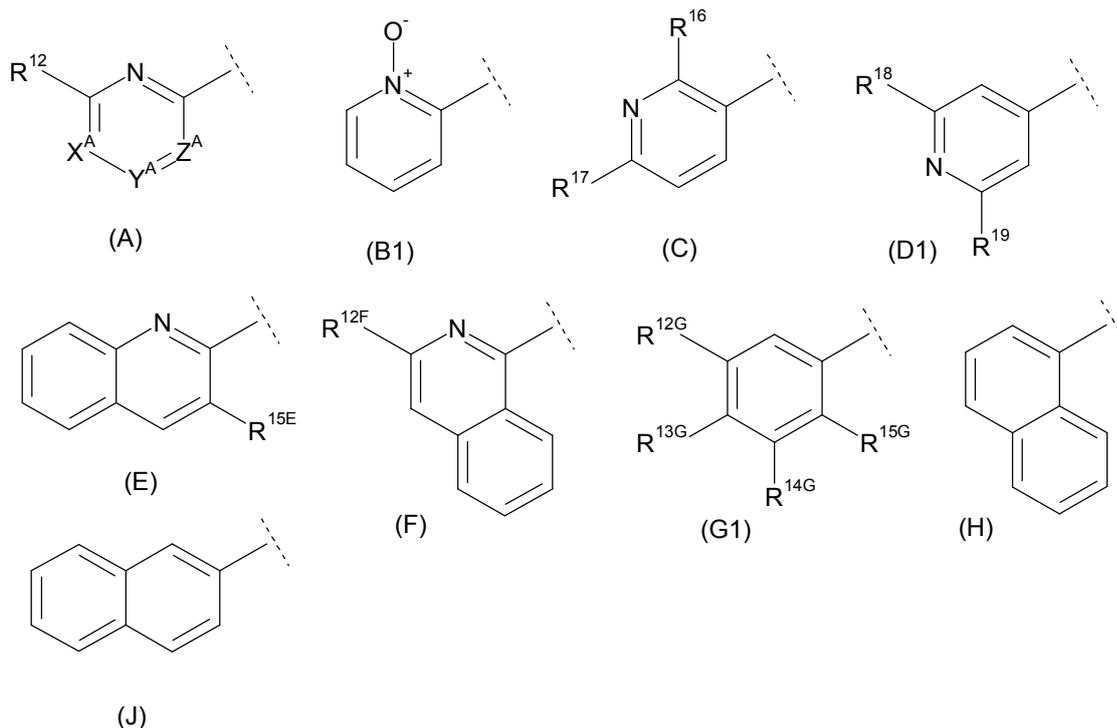
R² es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, fluorometilo (es decir, fluoroalquilo C₁), fluoroetilo (es decir, fluoroalquilo C₂), vinilo, prop-1-enilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, 2-fluoroetinilo, 2-(trifluorometil)etinilo, but-1-inilo, 2-(ciclopropil)etinilo, halógeno o (fluoroalquil C₁-C₂)metoxi-;

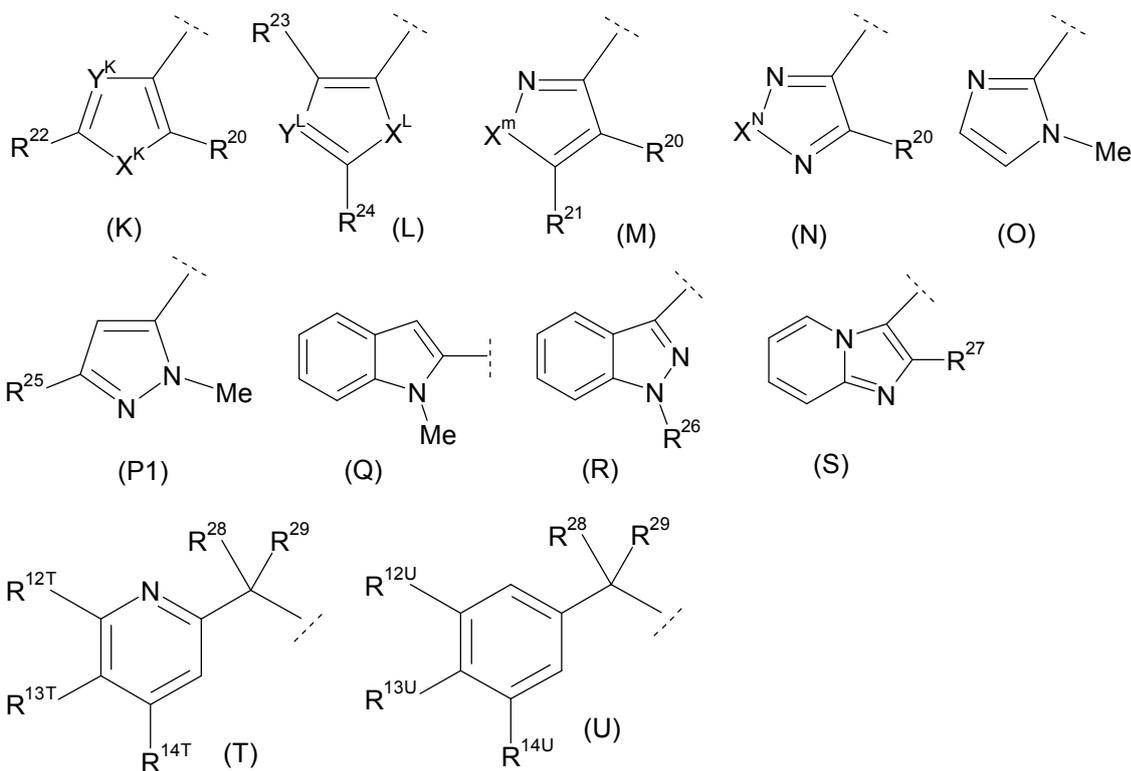
20 o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro;

o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro; y

R¹¹ es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, tetrahidro-2*H*-piranilo o tetrahydrofuranilo;

25 o R¹¹ es una de las siguientes subfórmulas A, B1, C, D1, E, F, G1, H, J, K, L, M, N, O, P1, Q, R, S, T o U:





donde:

X^A es nitrógeno o CR^{13} ;

5 Y^A es nitrógeno o CR^{14} ;

Z^A es nitrógeno o CR^{15} ;

siempre que no más de uno de los grupos X^A , Y^A y Z^A sea nitrógeno; y

R^{12} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 - C_2 , alcoxi C_1 - C_2 , fluoroalcoxi C_1 - C_2 , ciano, amino o fenilo opcionalmente sustituido en una o más de las posiciones *meta* y/o *para* con 1 o 2 sustituyentes flúor;

10 R^{13} es hidrógeno, flúor, cloro, metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano;

R^{14} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo o fluoroalquilo C_1 ;

R^{15} es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 , metoxi, fluoroalcoxi C_1 , ciano o amino;

siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

15 y siempre que, cuando R^{12} sea yodo, amino o fenilo opcionalmente sustituido, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea CR^{14} , Z^A sea CR^{15} , y R^{13} , R^{14} y R^{15} sean independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{13} , R^{14} y R^{15} sean hidrógeno;

y siempre que, cuando R^{15} sea amino, entonces X^A sea CR^{13} , Y^A sea nitrógeno o CR^{14} ,

Z^A es CR^{15} , y R^{13} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 , y R^{12} y R^{14} son hidrógeno; y

R^{16} es hidrógeno, flúor o cloro;

20 R^{17} es hidrógeno, flúor, cloro, metilo o fluoroalquilo C_1 ;

siempre que no más de uno de los grupos R^{16} y R^{17} sea hidrógeno;

R^{18} es cloro;

R^{19} es flúor, cloro, metoxi, fluoroalcoxi C_1 , metilo o fluoroalquilo C_1 ;

R^{15E} es hidrógeno, flúor o cloro;

- R^{12F} es hidrógeno, flúor o cloro;
- R^{12G} es hidrógeno, flúor o cloro;
- R^{13G} es hidrógeno, flúor, cloro, fluoroalquilo C_1 , metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;
- R^{14G} es hidrógeno o flúor;
- 5 R^{15G} es hidrógeno, flúor, cloro, metoxi o fluoroalcoxi C_1 ;
- siempre que al menos dos (es decir, dos, tres o todos) de los grupos R^{12G} , R^{13G} , R^{14G} y R^{15G} sean hidrógeno;
- X^K es O o S; e Y^K es C-H o N;
- X^L es O, S o N-Me; e Y^L es C-H o N; siempre que cuando X^L sea N-Me entonces Y^L no sea N;
- X^m es O, S o N-Me;
- 10 X^N es O, S o N-Me;
- R^{20} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- R^{21} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- R^{22} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- R^{23} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- 15 R^{24} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- R^{25} es hidrógeno, metilo o fluoroalquilo C_1 ;
- R^{26} es hidrógeno o metilo; y
- R^{27} es hidrógeno o metilo; y
- R^{28} y R^{29} son independientemente hidrógeno o flúor;
- 20 R^{12T} , R^{13T} y R^{14T} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12T} , R^{13T} y R^{14T} sean hidrógeno; y
- R^{12U} , R^{13U} y R^{14U} son independientemente hidrógeno o flúor, siempre que al menos dos (es decir, dos o tres) de los grupos R^{12U} , R^{13U} y R^{14U} sean hidrógeno;
- y donde:
- 25 G es hidrógeno; un metal agrícolamente aceptable, o un grupo sulfonio o amonio agrícolamente aceptable; o
- G es $-C(X^a)-R^a$, $-C(X^b)-X^c-R^b$, $-C(X^d)-N(R^c)-R^d$, $-SO_2-R^e$, $-P(X^e)(R^f)-R^g$, o $-CH_2-X^f-R^h$; o fenil- CH_2 - o fenil- CH (alquil C_1 - C_2)- (en cada uno de los cuales el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1 - C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o heteroaril- CH_2 - o heteroaril- CH (alquil C_1 - C_2)- (en cada uno de los cuales el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1 - C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro), o fenil- $C(O)-CH_2$ - (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1 - C_2 , fluoroalquilo C_1 , alcoxi C_1 - C_2 , fluoroalcoxi C_1 , flúor, cloro, bromo, ciano o nitro); o (alcoxi C_1 - C_6)- $C(O)-CH_2$ -, (alquil C_1 - C_6)- $C(O)-CH_2$ -, (alcoxi C_1 - C_6)- $C(O)-CH=CH$ -, (alquen C_2 - C_7)-1-il- CH_2 -, (alquen C_2 - C_7)-1-il- CH (alquil C_1 - C_2)-, (fluoroalquen C_2 - C_4)-1-il- CH_2 -, (alquin C_2 - C_7)-1-il- CH_2 - o (alquin C_2 - C_7)-1-il- CH (alquil C_1 - C_2)-;
- 30 y donde
- 35 R^h es alquilo C_1 - C_{10} , alqueno C_3 - C_{10} , alquino C_3 - C_{10} , fluoroalquilo C_1 - C_{10} , cianoalquilo C_1 - C_{10} , nitroalquilo C_1 - C_{10} , aminoalquilo C_2 - C_{10} , (alquilamino C_1 - C_5)-(alquilo C_1 - C_5), (dialquilamino C_2 - C_8)-(alquilo C_1 - C_5), (cicloalquilo C_3 - C_7)-(alquilo C_1 - C_5), (alcoxi C_1 - C_5)-(alquilo C_1 - C_5), (alquenoiloxi C_3 - C_5)-(alquilo C_1 - C_5), (alquinoiloxi C_3 - C_5)-(alquilo C_1 - C_5), (alquilsulfonilo C_1 - C_5)-(alquilo C_1 - C_5), (alquilidenedaminoxi C_2 - C_8)-(alquilo C_1 - C_5), (alquil C_1 - C_5)carbonil-(alquilo C_1 - C_5), (alcoxi C_1 - C_5)carbonil-(alquilo C_1 - C_5), aminocarbonil-(alquilo C_1 - C_5), (alquilamino C_1 - C_5)carbonil-(alquilo C_1 - C_5), (dialquilamino C_2 - C_8)carbonil-(alquilo C_1 - C_5), (alquil C_1 - C_5)carbonilamino-(alquilo C_1 - C_5), *N*-(alquil C_1 - C_5)carbonil-*N*-(alquilamino C_1 - C_5)-(alquilo C_1 - C_5), (trialquilsilil C_3 - C_6)-(alquilo C_1 - C_5), fenil(alquilo C_1 - C_5) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C_1 - C_3 , fluoroalquilo C_1 - C_3 , alcoxi C_1 - C_3 , fluoroalcoxi C_1 - C_3 , alquiltio C_1 - C_3 , alquilsulfonilo C_1 - C_3 , alquilsulfonilo C_1 - C_3 , halógeno, ciano o nitro), heteroaril-(alquilo C_1 - C_5) (donde el heteroarilo está sustituido
- 40
- 45

opcionalmente con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fenoxi(alquilo C₁-C₅) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), heteroariloxi-(alquilo C₁-C₅) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro), fluoroalqueno C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₆; fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; (alquil C₁-C₆)-C(O)-; o fenil-C(O)- donde el fenilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁, alcoxi C₁-C₂, fluoroalcoxi C₁, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro;

donde el término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo anular y está constituido por un único anillo o por dos anillos condensados;

15 y donde el compuesto de fórmula (I) está opcionalmente presente como una de sus sales agroquímicamente aceptables.

4. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 1, 2 o 3, donde:

cuando G es -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b, entonces

X^a y X^b son oxígeno,

20 X^c es oxígeno o azufre,

R^a es alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, (alcoxi C₁-C₄)-(alquilo C₁-C₄), (cicloalquil C₃-C₆)-(alquilo C₁-C₂), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₂, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₂, flúor, cloro, bromo o ciano; y

R^b es alquilo C₁-C₁₀, (alqueno C₂-C₅)-CH₂-, (alqueno C₂-C₄)-CH(Me)-, (alquino C₂-C₅)-CH₂-, (alquino C₂-C₄)-CH(Me)-, cicloalquilo C₃-C₆, (alcoxi C₁-C₄)-(alquilo C₁-C₄), (cicloalquil C₃-C₆)-(alquilo C₁-C₂), o fenilo o fenilo sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₂, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros o un heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con 1, 2 o 3 de, independientemente, alquilo C₁-C₃, fluoroalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₃, fluoroalcoxi C₁-C₂, flúor, cloro, bromo o ciano.

5. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 1, 2, 3 o 4, donde R¹ es metilo, etilo, etinilo, cloro, bromo o metoxi.

35 6. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 1, 2, 3, 4 o 5, donde R³ es hidrógeno, metilo, etilo, etinilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o fluorometoxi (es decir, fluoroalcoxi C₁).

7. Un compuesto como el que se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1-6, donde:

R² es metilo, etinilo, prop-1-inilo, 2-cloroetinilo, cloro o bromo;

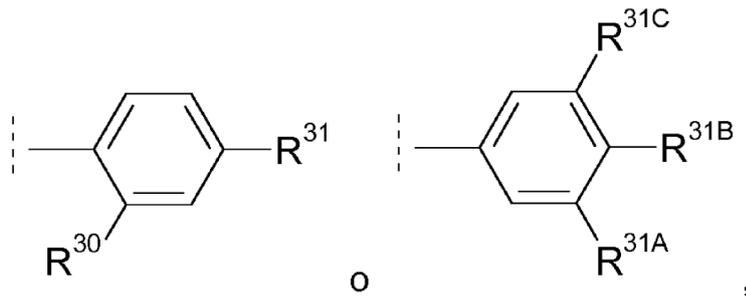
o R² es fenilo opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂ o ciano;

40 o R² es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido con 1 o 2 de, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₂, fluoroalquilo C₁-C₂, ciano o nitro;

o R² es (fluoroalquil C₁)-metoxi-.

8. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 7, donde:

cuando R² es fenilo opcionalmente sustituido, entonces R² es



donde:

R^{30} es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C_1 ;

R^{31} es flúor, cloro, fluoroalquilo C_1 o metilo ;

5 R^{31A} es flúor o cloro;

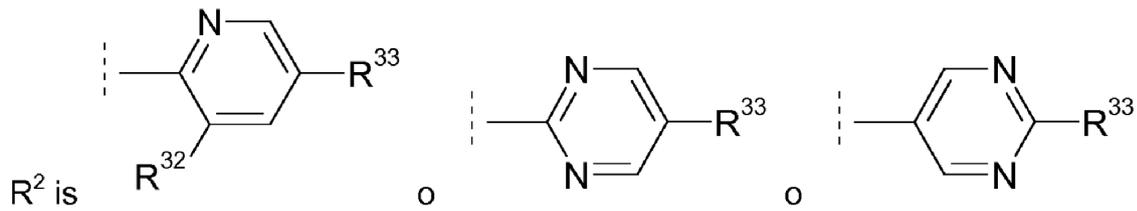
R^{31B} es hidrógeno, flúor o cloro ; y

R^{31C} es hidrógeno, flúor o cloro ;

donde uno o ambos de R^{31B} y R^{31C} es o son hidrógeno ;

y

10 cuando R^2 es heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido, entonces R^2 es



donde:

R^{32} es hidrógeno, flúor, cloro o fluoroalquilo C_1 ; y

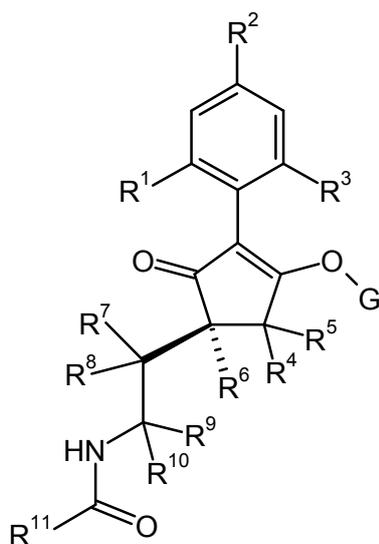
R^{33} es flúor, cloro o fluoroalquilo C_1 ;

15 R^{34} es flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano; y

R^{35} es flúor, cloro, bromo, metilo, fluoroalquilo C_1 o ciano.

9. Un compuesto como el que se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1-8, donde todos los grupos R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son hidrógeno.

20 10. Un compuesto como el que se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1-9, donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (IC):



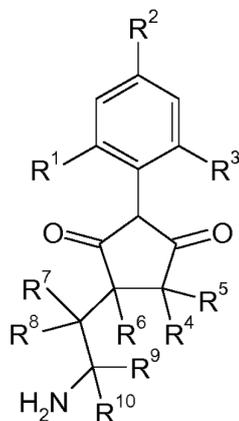
(IC),

donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} y G son como se han definido en cualquiera de las reivindicaciones anteriores,

5 y donde un porcentaje mayor o igual al 40% en molaridad del compuesto de fórmula (IC) tiene la estereoquímica indicada en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$.

11. Un compuesto como el que se reivindica en la reivindicación 10, donde un porcentaje mayor al 50% en molaridad del compuesto de fórmula (IC) tiene la estereoquímica indicada en el átomo de carbono anular enlazado a R^6 y $-CR^7R^8-CR^9R^{10}-NHC(O)-R^{11}$.

12. Un compuesto de fórmula (Q):



(Q)

10 o una de sus sales, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son como se han definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-9.

13. Una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (I), tal como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-11, y un portador, diluyente y/o disolvente agroquímicamente aceptable.

15 14. Una composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 13, que comprende uno o más herbicidas adicionales y/o un protector.

15. Un método para controlar malezas monocotiledóneas herbáceas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar un compuesto de fórmula (I), tal como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-11, o una composición herbicida que comprende dicho compuesto, a las plantas o a su emplazamiento.