

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 659 553**

51 Int. Cl.:

<b>A01P 13/00</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/713</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/90</b>	(2006.01)
<b>C07D 401/12</b>	(2006.01)
<b>C07D 257/04</b>	(2006.01)
<b>C07D 257/06</b>	(2006.01)
<b>C07D 495/10</b>	(2006.01)
<b>C07D 471/04</b>	(2006.01)

12

## TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **20.12.2012 PCT/EP2012/076339**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **27.06.2013 WO13092834**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **20.12.2012 E 12809812 (6)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **20.12.2017 EP 2793589**

54 Título: **Compuestos herbicidas**

30 Prioridad:

**21.12.2011 GB 201122137**  
**16.03.2012 GB 201204724**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**16.03.2018**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**ELLIOTT, ALISON CLARE y**  
**MITCHELL, GLYNN**

74 Agente/Representante:

**LEHMANN NOVO, María Isabel**

**ES 2 659 553 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).

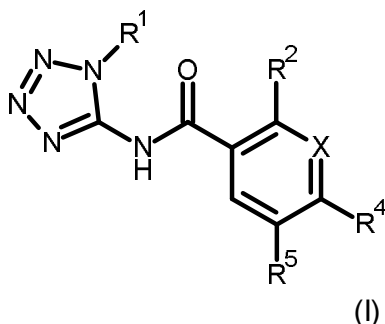
## DESCRIPCIÓN

Compuestos herbicidas

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

10 El documento WO 2004/101532 divulga compuestos de triazol carboxamida sustituidos como herbicidas.

Por tanto, de acuerdo con la presente invención se proporciona un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (I):



15

o una sal agronómicamente aceptable del mismo, donde:-

20  $R^1$  se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo $C_{1-6}$ , haloalquilo $C_{1-6}$  y alcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-3}$ ;

$R^2$  se selecciona del grupo que consiste en alquilo $C_{1-6}$ , haloalquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-3}$ -alcoxi $C_{2-3}$ -alquilo $C_{1-3}$ , halógeno, ciano, nitro, alquilo $C_{1-6}$ -S(O) $_p$ - y haloalquilo $C_{1-6}$ -S(O) $_p$ ;

25 X es CR<sup>3</sup> o N;

$R^3$  se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo $C_{1-6}$ , haloalquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , haloalcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ -alcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ , haloalcoxi $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ -alcoxi $C_{1-6}$ , alquilamino $C_{1-6}$ , dialquilamino $C_{1-6}$ , piperidino, morfolino, ciano, alquilo $C_{1-6}$ -S(O) $_p$ - y haloalquilo $C_{1-6}$ -S(O) $_p$ ;

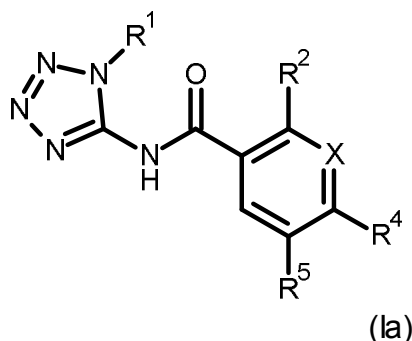
30

$R^4$  y  $R^5$  juntos forman un anillo aromático de 5 o 6 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo de nitrógeno, estando el anillo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más  $R^6$ ;

35  $R^6$  se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquilo $C_{1-6}$ , haloalquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , haloalcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$ -alcoxi $C_{1-6}$ -alquilo $C_{1-6}$ , alcoxi $C_{1-6}$  y haloalcoxi $C_{1-6}$ ; y

$p = 0, 1$  o  $2$ .

40 También se divulga un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (Ia):



o una sal agronómicamente aceptable del mismo,  
donde:-

- 5 R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;
- R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, ciano, nitro, alquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-;
- 10 X es CR<sup>3</sup> o N;
- R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxialcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminoC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminoC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, piperidino, morfolino, ciano, alquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-;
- 15 R<sup>4</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, ciano, nitro, alquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-;
- 20 o R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> juntos forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo de oxígeno o S(O)<sub>p</sub>, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>6</sup>,
- 25 R<sup>5</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;
- o R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> juntos forman un anillo aromático de 5 o 6 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo de nitrógeno, estando el anillo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>6</sup>;
- 30 R<sup>6</sup> se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y
- p = 0, 1 o 2.
- Existen las siguientes preferencias con respecto al compuesto de fórmula (I) y fórmula (Ia).
- 35 Preferentemente, R<sup>1</sup> es metilo.
- Preferentemente, R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en metilo, flúor, cloro, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-.
- 40 Halógeno (o halo) abarca flúor, cloro, bromo o yodo. Lo mismo se aplica correspondientemente a halógeno en el contexto de otras definiciones, tales como haloalquilo o halofenilo.
- Los grupos haloalquilo que tienen una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono son, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1-difluoro-2,2,2-tricloroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoroetilo y 2,2,2-tricloroetilo, heptafluoro-n-propilo y perfluoro-n-hexilo.
- 45 Los grupos alcoxi tienen preferentemente una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxi es, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi o terc-butoxi o un isómero de pentiloxi o hexiloxi, preferentemente metoxi y etoxi. También debe apreciarse que dos sustituyentes alcoxi presentes en el mismo átomo de carbono pueden unirse para formar un grupo espiránico. Por tanto, los grupos metilo presentes en dos sustituyentes metoxi pueden unirse para formar un sustituyente 1,3-dioxolano espiránico, por ejemplo. Este tipo de posibilidad queda contemplada por el alcance de la presente invención.
- 50

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

5 Alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S- (alquiltio) es, por ejemplo, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio o terc-butiltio, preferentemente metiltio o etiltio.

Alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)- (alquilsulfinilo) es, por ejemplo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, isopropilsulfinilo, n-butilsulfinilo, isobutilsulfinilo, sec-butilsulfinilo o terc-butilsulfinilo, preferentemente metilsulfinilo o etilsulfinilo.

10 Alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>2</sub>- (alquilsulfonilo) es, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, sec-butilsulfonilo o terc-butilsulfonilo, preferentemente metilsulfonilo o etilsulfonilo.

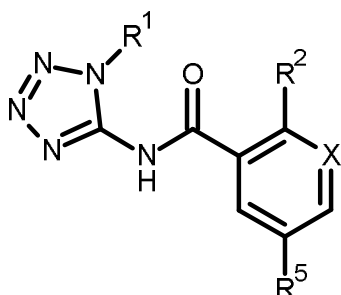
Alquilamino es, por ejemplo, metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino o un isómero butilamino.

15 Dialquilamino es, por ejemplo, dimetilamino, metiletilamino, dietilamino, n-propilmetilamino, dibutilamino o diisopropilamino. Se da preferencia a los grupos alquilamino con una longitud de cadena de 1 a 4 átomos de carbono.

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

20 También se divulga un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (Ib):-

25



(Ib)

o una sal agronómicamente aceptable del mismo, donde:-

30 R<sup>1</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, haloalquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub> y alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub></sub> (más preferentemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, mucho más preferentemente metilo);

35 R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, haloalquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub></sub>-alcoxi<sub>C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub></sub>-alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub></sub>, halógeno, ciano, nitro, alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>p</sub>- (más preferentemente R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, haloalquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, halógeno, ciano, nitro, alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>p</sub>-, incluso más preferentemente R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en metilo, flúor, cloro, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-);

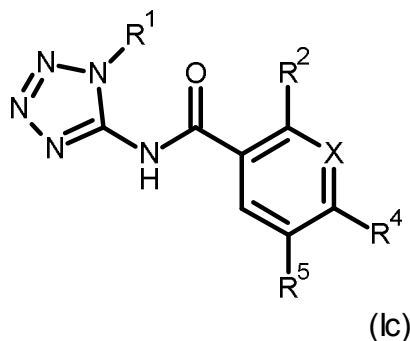
40 X es CR<sup>3</sup> o N (más preferentemente CR<sup>3</sup>);

45 R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, haloalquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, haloalcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, haloalcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-alcoxi<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, alquilamino<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, dialquilamino<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, piperidino, morfolino, ciano, alquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquil<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>-S(O)<sub>p</sub>-);

R<sup>5</sup> se selecciona del grupo que consiste en, hidrógeno, halógeno, alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub> y haloalquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub> (como alternativa hidrógeno o alquilo<sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub></sub>, como alternativa hidrógeno o metilo); y

50 p = 0, 1 o 2.

También se divulga un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (Ic):-



5 o una sal agronómicamente aceptable del mismo,  
donde:-

10 R<sup>1</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub> y alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-3</sub> (más preferentemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno y alquiloC<sub>1-6</sub>, mucho más preferentemente metilo);

R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquilC<sub>1-6</sub>-, haloalquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-3</sub>-alcoxiC<sub>2-3</sub>-alquilC<sub>1-3</sub>-, halógeno, ciano, nitro, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- (más preferentemente R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquilC<sub>1-6</sub>-, haloalquilC<sub>1-6</sub>-,

15 alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquilC<sub>1-6</sub>-, halógeno, ciano, nitro, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-, incluso más preferentemente R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en metilo, flúor, cloro, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-);

X es CR<sup>3</sup> o N (más preferentemente CR<sup>3</sup>);

20 R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alcoxiC<sub>1-6</sub>, alquilaminoC<sub>1-6</sub>, dialquilaminoC<sub>1-6</sub>-, piperidino, morfolino, ciano, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-);

25 R<sup>4</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, halo, ciano, nitro, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- (más preferentemente R<sup>4</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-);

30 o R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> juntos forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo de oxígeno o S(O)<sub>p</sub>, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>6</sup>,

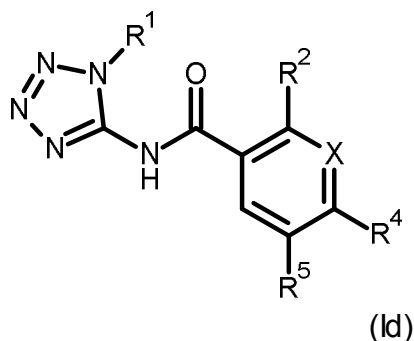
35 R<sup>5</sup> se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquiloC<sub>1-6</sub> y haloalquiloC<sub>1-6</sub> (más preferentemente, R<sup>5</sup> se selecciona del grupo que consiste en halógeno (preferentemente flúor o cloro), alquiloC<sub>1-6</sub> y haloalquiloC<sub>1-6</sub>, más preferentemente R<sup>5</sup> se selecciona del grupo que consiste en cloro, flúor y metilo. Como alternativa, R<sup>5</sup> es alquiloC<sub>1-6</sub>, preferentemente metilo);

R<sup>6</sup> se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-6</sub> y haloalcoxiC<sub>1-6</sub>; y

40 p = 0, 1 o 2.

En otra realización de la presente invención, se proporciona un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (Id):-

45



o una sal agronómicamente aceptable del mismo, donde:-

5 R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (preferentemente metilo);

R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halo, ciano, nitro, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- (más preferentemente R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en metilo, flúor, cloro, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-);

10 X es CR<sup>3</sup> o N;

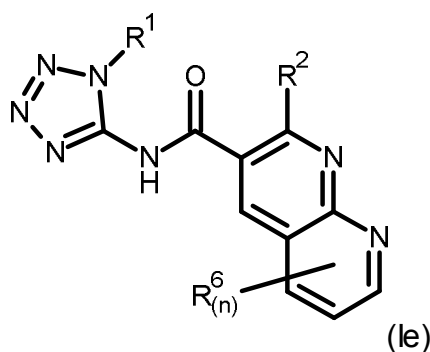
R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminoC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminoC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, piperidino, morfolino, ciano, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-;

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> juntos forman un anillo aromático de 5 o 6 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo de nitrógeno, estando el anillo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>6</sup>;

20 R<sup>6</sup> se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y

25 p = 0, 1 o 2.

En otra realización de la presente invención, se proporciona un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (Ie):-



30 o una sal agronómicamente aceptable del mismo, donde:-

35 R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (preferentemente metilo);

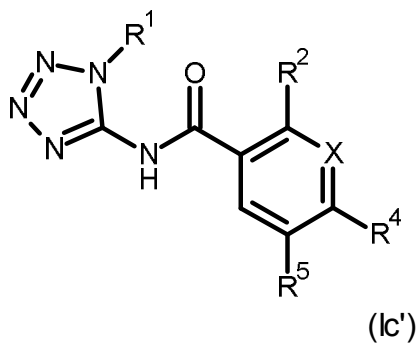
R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, ciano, nitro, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- (más preferentemente R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en metilo, flúor, cloro, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-);

40 R<sup>6</sup> se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y

n = 0, 1, 2 o 3 (preferentemente 1 o 2); y

p = 0, 1 o 2.

5 También se divulga un compuesto de fórmula (Ic'):-



10 o una sal agronómicamente aceptable del mismo, donde:-

R<sup>1</sup> es metilo;

15 R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en metilo, flúor, cloro, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-;

X es CH;

R<sup>4</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, trifluorometilo y metil-S(O)<sub>2</sub>-; y

20 R<sup>5</sup> se selecciona del grupo que consiste en cloro, flúor y metilo.

En otra realización de la presente invención, se proporciona un compuesto de fórmula (Ie) como se define anteriormente.

25 Los compuestos de fórmula I etc. pueden contener centros asimétricos y pueden estar presentes como un enantiómero individual, pares de enantiómeros en cualquier proporción o, cuando hay más de un centro asimétrico presente, contienen diastereoisómeros en todas las relaciones posibles.

30 Habitualmente, uno de los enantiómeros tiene una actividad biológica potenciada en comparación con las otras posibilidades.

Asimismo, en los casos en los que haya alquenos disustituidos, estos pueden estar presentes en la forma *E* o *Z* o como mezclas de ambas en cualquier proporción.

35 Además, los compuestos de fórmula I etc. pueden estar en equilibrio con formas tautoméricas de hidroxilo alternativas. Se apreciará que todas las formas tautoméricas (tautómeros individuales o mezclas de los mismos), mezclas racémicas e isómeros individuales están incluidos dentro del alcance de la presente invención.

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

45 Los compuestos de fórmula (I) etc. de acuerdo con la invención pueden usarse como herbicidas en sí mismos, pero generalmente se formulan en composiciones herbicidas usando adyuvantes de formulación, tales como vehículos, disolventes y agentes tensioactivos (AT). Por tanto, la presente invención proporciona además una composición herbicida que comprende un compuesto herbicida de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones previas y un adyuvante de formulación agronómicamente aceptable. La composición puede estar en forma de concentrados que se diluyen antes de usarlos, aunque también se pueden preparar composiciones listas para usar. La dilución final se suele hacer con agua, pero se puede hacer, en lugar de con agua, o además de con esta, con, por ejemplo, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

Las composiciones herbicidas generalmente comprenden de un 0,1 a un 99% en peso, especialmente de un 0,1 a un 95% en peso, de compuestos de fórmula I, y de un 1 a un 99,9% en peso de un adyuvante de formulación que incluye preferentemente de un 0 a un 25% en peso de una sustancia tensioactiva.

5 Las composiciones se pueden elegir entre varios tipos de formulaciones, muchas de las cuales se describen en el Manual Sobre el Desarrollo y el Uso de las Especificaciones para Productos para la Protección de Plantas de la FAO, 5.ª Edición, 1999. Estas incluyen polvos espolvoreables (PE), polvos solubles (PS), gránulos solubles en agua (GS), gránulos dispersables en agua (GD), polvos humectables (PH), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida),  
10 concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (LAc), líquidos de volumen ultrabajo (LU), concentrados emulsionables (CE), concentrados dispersables (CD), emulsiones (tanto de aceite en agua (EAg) como de agua en aceite (EAc)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (CS), aerosoles, suspensiones de cápsulas (SC) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido en cualquier caso dependerá del objetivo específico previsto y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula (I).

15 Los polvos espolvoreables (PE) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo, arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, diatomita, carbonato de calcio, tierras diatomáceas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta un polvo fino.

20 Los polvos solubles (PS) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tales como polisacáridos) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersibilidad/solubilidad en agua. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se  
25 pueden granular composiciones similares para formar gránulos solubles en agua (GS).

Los polvos humectables (PH) se pueden preparar mezclando el compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. A continuación, la mezcla  
30 se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (GD).

Los gránulos (GR) se pueden formar granulando una mezcla de un compuesto de fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o a partir de gránulos sin tratar preformados por absorción de un compuesto de fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de batán, diatomita, tierras diatomáceas o mazorcas de maíz molidas) o adsorbiendo el  
35 compuesto de fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) sobre un material central duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos) y secando si fuera necesario. Los agentes que se emplean habitualmente para facilitar la absorción o adsorción incluyen disolventes (tales como alcoholes, éteres, cetonas, ésteres y disolventes del petróleo aromáticos y alifáticos) y agentes aglutinantes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir uno o más aditivos diferentes en los gránulos (por ejemplo, un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).

40 Los concentrados dispersables (CD) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en agua o un disolvente orgánico tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo, para mejorar la dilución en agua o evitar la cristalización en un tanque de pulverización).

Los concentrados emulsionables (CE) o las emulsiones de aceite en agua (EAg) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en un disolvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para  
50 emplear en CE incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo, SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca comercial registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), *N*-alquilpirrolidonas (tales como *N*-metilpirrolidona o *N*-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de un ácido graso C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>) e hidrocarburos clorados. Un producto de tipo CE puede emulsionar espontáneamente al añadir agua, para producir una emulsión con una estabilidad suficiente para permitir la aplicación por pulverización con un equipo adecuado.

60 La preparación de una EAg implica obtener un compuesto de fórmula (I), ya sea como un líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable, normalmente inferior a 70°C) o en solución (disolviéndolo en un disolvente adecuado), y a continuación emulsionar el líquido o la solución resultante en agua que contenga uno o más AT, con un cizallamiento elevado, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para emplear en EAg incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que presenten  
65 una solubilidad baja en agua.



- Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más AT, para producir de forma espontánea una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Hay un compuesto de fórmula (I) presente inicialmente en el agua o en la mezcla de disolventes/AT. Los disolventes adecuados para emplear en las ME incluyen los descritos previamente en la presente para emplear en CE o en EAg.
- 5 Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (se puede determinar qué sistema está presente mediante medidas de conductividad) y puede ser adecuada para mezclar pesticidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es adecuada para diluirla en agua, en cuyo caso se puede mantener como una microemulsión o puede formar una emulsión de aceite en agua convencional.
- 10 Los concentrados en suspensión (CS) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula (I). Los CS se pueden preparar moliendo el compuesto de fórmula (I) sólido con un molino de bolas o de microsferas en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la
- 15 velocidad a la que sedimentan las partículas. Como alternativa, un compuesto de fórmula (I) puede molerse en seco y añadirse a agua, que contenga agentes descritos anteriormente en la presente, para producir el producto final deseado.
- 20 Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula (I) y un propulsor adecuado (por ejemplo, *n*-butano). Un compuesto de fórmula (I) también pueden disolverse o dispersarse en un medio adecuado (por ejemplo, agua o un líquido miscible en agua, tal como *n*-propanol) para proporcionar composiciones para su uso en bombas de pulverización no presurizadas, accionadas manualmente.
- 25 Las suspensiones de cápsulas (SC) se pueden preparar de una manera similar a la preparación de formulaciones de EAg, pero con una fase de polimerización adicional de modo que se obtenga una dispersión acuosa de gotas de aceite, en que cada gota de aceite está encapsulada por una cubierta polimérica y contiene un compuesto de fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para el mismo. La cubierta polimérica se puede producir mediante una reacción de policondensación interfacial o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una liberación controlada del compuesto de fórmula (I) y se pueden utilizar para el tratamiento de semillas. Un compuesto de fórmula (I) también puede formularse en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación lenta y controlada del compuesto.
- 30 La composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición, por ejemplo, mejorando la humectación, retención o distribución en superficies; la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la captación o movilidad de un compuesto de fórmula (I). Los aditivos de este tipo incluyen agentes tensioactivos (TA), aditivos de pulverización de base oleosa, por ejemplo, determinados aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y de semilla de colza) y mezclas de estos con otros adyuvantes biopotenciadores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de fórmula (I)).
- 35 Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser AT de tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.
- 40 Los AT de tipo catiónico adecuados incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo, bromuro de cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.
- 45 Los AT aniónicos adecuados incluyen sales de metales alcalinos de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo, laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonatados (por ejemplo, dodecilmecenosulfonato de sodio, dodecilmecenosulfonato de calcio, butilnaftalensulfonato y mezclas de di-*isopropil*- y tri-*isopropil*-naftalensulfonatos de sodio), sulfatos de éter, sulfatos de éter alcohólicos (por ejemplo, laureth-3-sulfato de sodio), carboxilatos de éter (por ejemplo laureth-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente diésteres), por ejemplo, la reacción entre alcohol laurílico y ácido tetrafosfórico; adicionalmente, estos productos pueden estar etoxilados), sulfosuccinatos, sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos de parafina u olefina.
- 50 Los AT de tipo anfótero adecuados incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.
- 55 Los AT de tipo no iónico adecuados incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales obtenidos a partir de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros en bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo, ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.
- 60 Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o
- 65

carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas esponjosas (tales como bentonita o atapulgita).

La composición de la presente puede comprender además al menos un pesticida adicional. Por ejemplo, los compuestos de acuerdo con la invención también se pueden utilizar combinados con otros herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas. En una realización preferida, el pesticida adicional es un herbicida y/o un protector para herbicidas. Ejemplos de dichas mezclas son (en que 'I' representa un compuesto de fórmula I, Ia, Ib, Ic, Ic', Id, le). I + acetoclor, I + acifluorfén, I + acifluorfén-sodio, I + aclonifén, I + acroleína, I + alaclor, I + aloxidim, I + ametrina, I + amicarbazona, I + amidosulfurón, I + aminopiridil, I + amitrol, I + anilofós, I + asulam, I + atrazina, I + azafenidina, I + azimsulfurón, I + BCPC, I + beflubutamida, I + benazolina, I + bencarbazona, I + benfluralina, I + benfuresato, I + bensulfurón, I + bensulfurón-metilo, I + bensulida, I + bentazona, I + benzfendizona, I + benzobiciclón, I + benzofenap, I + biciclopirona, I + bifenox, I + bilanafós, I + bispiribac, I + bispiribac-sodio, I + bórax, I + bromacilo, I + bromobutida, I + bromoxinilo, I + butaclor, I + butamifós, I + butralina, I + butroxidim, I + butilato, I + ácido cacodílico, I + clorato de calcio, I + cafenstrol, I + carbetamida, I + carfentrazona, I + carfentrazona-etilo, I + clorflurenol, I + clorflurenol-metilo, I + cloridazón, I + clorimurón, I + clorimurón-etilo, I + ácido cloroacético, I + clorotolurón, I + clorprofam, I + clorsulfurón, I + clortal, I + clortal-dimetilo, I + cinidón-etilo, I + cinmetilina, I + cinosulfurón, I + cisanilida, I + cletodim, I + clodinafop, I + clodinafop-propargilo, I + clomazona, I + clomeprop, I + clopiralid, I + cloransulam, I + cloransulam-metilo, I + cianazina, I + cicloato, I + ciclosulfamurón, I + cicloxidim, I + cihalofop, I + cihalofop-butilo, I + 2,4-D, I + daimurón, I + dalapón, I + dazomet, I + 2,4-DB, I + I + desmedifam, I + dicamba, I + diclobenilo, I + diclorprop, I + diclorprop-P, I + diclofop, I + diclofop-metilo, I + diclosulam, I + difenzoquat, I + metilsulfato de difenzoquat, I + diflufenicán, I + diflufenzopir, I + dimefurón, I + dimepiperato, I + dimetaclor, I + dimetametrina, I + dimetenamida, I + dimetenamida-P, I + dimetipina, I + ácido dimetilarsínico, I + dinitramina, I + dinoterb, I + difenamida, I + dipropetrina, I + diquat, I + dibromuro de diquat, I + ditiopir, I + diurón, I + endotal, I + EPTC, I + esprocarb, I + etalfluralina, I + etametsulfurón, I + etametsulfurón-metilo, I + etefón, I + etofumesato, I + etoxifeno, I + etoxisulfurón, I + etobenzanida, I + fenoxaprop-P, I + fenoxaprop-P-etilo, I + fentrazamida, I + sulfato ferroso, I + flamprom-M, I + flazasulfurón, I + florasulam, I + fluazifop, I + fluazifop-butilo, I + fluazifop-P, I + fluazifop-P-butilo, I + fluazolato, I + flucarbazona, I + flucarbazona-sodio, I + flucetosulfurón, I + fluclorealina, I + flufenacet, I + flufenpir, I + flufenpir-etilo, I + flumetralina, I + flumetsulam, I + flumiclorac, I + flumiclorac-pentilo, I + flumioxazina, I + flumipropina, I + fluometurón, I + fluoroglicofeno, I + fluoroglicofeno-etilo, I + fluoxaprop, I + flupoxam, I + flupropacilo, I + flupropanato, I + flupirsulfurón, I + flupirsulfurón-metil-sodio, I + flurenol, I + fluridona, I + flurocloridona, I + fluroxipir, I + flurtamona, I + flutiacet, I + flutiacet-metilo, I + fomesafeno, I + foramsulfurón, I + fosamina, I + glufosinato, I + glufosinato-amonio, I + glifosato, I + halosulfurón, I + halosulfurón-metilo, I + haloxifop, I + haloxifop-P, I + hexazinona, I + imazametabenz, I + imazametabenz-metilo, I + imazamox, I + imazapic, I + imazapir, I + imazaquina, I + imazetapir, I + imazosulfurón, I + indanofano, I + indaziflam, I + yodometano, I + yodosulfurón, I + yodosulfurón-metil-sodio, I + ioxinilo, I + isoproturón, I + isourón, I + isoxabeno, I + isoxaclortol, I + isoxaflutol, I + isoxapirifop, I + karbutilato, I + lactofeno, I + lenacilo, I + linurón, I + mecoprop, I + mecoprop-P, I + mefenacet, I + mefluidida, I + mesosulfurón, I + mesosulfurón-metilo, I + mesotriona, I + metamifop, I + metamitron, I + metataclor, I + metabenztiarurón, I + metazol, I + ácido metilarsínico, I + metildimrón, I + isotiocianato de metilo, I + metolaclor, I + S-metolaclor, I + metosulam, I + metoxurón, I + metribuzina, I + metsulfurón, I + metsulfurón-metilo, I + molinato, I + monolinurón, I + naproanilida, I + napropamida, I + naptalam, I + neburón, I + nicosulfurón, I + glifosato de n-metilo, I + ácido nonanoico, I + norflurazón, I + ácido oleico (ácidos grasos), I + orbencarb, I + ortosulfamurón, I + orizalina, I + oxadiargilo, I + oxadiazona, I + oxasulfurón, I + oxaziclomefona, I + oxifluorfeno, I + paraquat, I + dicloruro de paraquat, I + pebulato, I + pendimetalina, I + penoxsulam, I + pentaclorofenol, I + pentanoclor, I + pentoxazona, I + petoxamida, I + fenmedifam, I + picloram, I + picolinafeno, I + pinoxadeno, I + piperofós, I + pretilaclor, I + primisulfurón, I + primisulfurón-metilo, I + prodiamina, I + profoxidim, I + prohexadiona-calcio, I + prometón, I + prometrina, I + propaclor, I + propanilo, I + propaquizafop, I + propazina, I + profam, I + propisoclor, I + propoxicarbazona, I + propoxicarbazona-sodio, I + propizamida, I + prosulfocarb, I + prosulfurón, I + piraclonilo, I + piraflufeno, I + piraflufeno-etilo, I + pirasulfotol, I + pirazolinato, I + pirazosulfurón, I + pirazosulfurón-etilo, I + pirazoxifeno, I + piribenzoxim, I + piributicarb, I + piridafol, I + piridato, I + pirifalida, I + piriminobac, I + piriminobac-metilo, I + pirimisulfano, I + piritiobac, I + piritiobac-sodio, I + piroxasulfona, I + piroxsulam, I + quinclorac, I + quinmerac, I + quinoclamina, I + quizalofop, I + quizalofop-P, I + rimsulfurón, I + saflufenacilo, I + setoxidim, I + sidurón, I + simazina, I + simetrina, I + clorato de sodio, I + sulcotriona, I + sulfentrazona, I + sulfometurón, I + sulfometurón-metilo, I + sulfosato, I + sulfosulfurón, I + ácido sulfúrico, I + tebutiurón, I + tefuriltriona, I + tembotriona, I + tepraloxidim, I + terbacilo, I + terbumetona, I + terbutilazina, I + terbutrina, I + tenilclor, I + tiazopir, I + tifensulfurón, I + tiencarbazona, I + tifensulfurón-metilo, I + tiobencarb, I + topramezona, I + tralkoxidim, I + tri-alato, I + triasulfurón, I + triaziflam, I + tribenurón, I + tribenurón-metilo, I + tricopir, I + trietazina, I + trifloxisulfurón, I + trifloxisulfurón-sodio, I + trifluralina, I + triflursulfurón, I + triflursulfurón-metilo, I + trihidroxitriazina, I + trinexapac-etilo, I + tritósulfurón, 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)oxo]-2-piridilo]acético) (n.º de reg. CAS 353292-31-6). Los compuestos de la presente invención también se pueden combinar con compuestos herbicidas divulgados en los documentos WO 06/024820 y/o WO 07/096576.

Los compañeros de mezcla del compuesto de fórmula I también pueden estar en forma de ésteres o sales, como se menciona, por ejemplo, en *The Pesticide Manual*, decimocuarta edición, Consejo Británico para la Protección de Cultivos, 2006.

El compuesto de fórmula I también puede emplearse en mezclas con otros agentes agroquímicos tales como

fungicidas, nematocidas o insecticidas, cuyos ejemplos se proporcionan en *The Pesticide Manual*.

La proporción en la mezcla del compuesto de fórmula I respecto al componente de la mezcla que lo acompaña es preferentemente de 1: 100 a 1000:1.

5 Las mezclas pueden usarse ventajosamente en las formulaciones mencionadas anteriormente (en cuyo caso el "principio activo" se refiere a la mezcla respectiva de compuesto de fórmula I con el compañero de mezcla).

10 Los compuestos de fórmula I etc. de acuerdo con la invención también se pueden usar combinados con uno o más protectores. Asimismo, también pueden emplearse mezclas de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la invención con uno o más herbicidas adicionales combinados con uno o más protectores. Los protectores pueden ser AD 67 (MON 4660), benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciprosulfamida (n.º de reg. CAS 221667-31-8), diclormida, fenclorazol-etilo, fenclorim, fluxofenim, furilazol y el isómero R correspondiente, isoxadifeno-etilo, mefenpir-dietilo, oxabetrinilo, *N*-isopropil-4-(2-metoxibenzoilsulfamoil)benzamida (n.º de reg. CAS 221668-34-4). Otras posibilidades incluyen compuestos protectores divulgados, por ejemplo, en el documento EP0365484, por ejemplo, *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida. Particularmente se prefieren mezclas de un compuesto de fórmula I con ciprosulfamida, isoxadifeno-etilo, cloquintocet-mexilo y/o *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida.

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

25 Preferentemente, la proporción en la mezcla del compuesto de fórmula I respecto al protector es de 100:1 a 1:10, especialmente de 20:1 a 1:1.

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

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

40 Las tasas de aplicación de los compuestos de fórmula I etc. pueden variar dentro de límites amplios y dependen de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (antes o después de la germinación; riego superficial de las semillas; aplicación al surco de las semillas; aplicación a tierra no labrada, etc.), la planta de cultivo, la maleza a controlar, las condiciones climáticas predominantes y otros factores regidos por el método de aplicación, el momento de la aplicación y el cultivo diana. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención se aplican generalmente a una tasa de 10 a 2000 g/ha, especialmente de 50 a 1000 g/ha.

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

50 Las plantas útiles en las que puede usarse la composición de acuerdo con la invención incluyen cultivos tales como cereales, por ejemplo, cebada y trigo, algodón, colza oleaginosa, girasol, maíz, arroz, soja, remolacha azucarera, caña de azúcar y pasto.

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

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

65 También se debe sobrentender que los cultivos también son aquellos que se han modificado para que sean

resistentes a insectos nocivos mediante métodos de ingeniería genética, por ejemplo, el maíz Bt (resistente al barrenador de maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo del algodón) y también patatas 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 manera natural por la bacteria del suelo *Bacillus thuringiensis*. Algunos ejemplos de toxinas, o plantas transgénicas capaces de sintetizar dichas toxinas, se describen 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. Algunos ejemplos de plantas transgénicas que comprenden uno o más genes que codifican una resistencia a insecticidas y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y el material seminal de los mismos pueden ser resistentes a herbicidas y, al mismo tiempo, también resistentes a la alimentación por insectos (eventos transgénicos "acumulados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 insecticida y a la vez ser tolerantes a glifosato.

También se debe sobrentender que los cultivos incluyen aquellos que se obtienen mediante métodos convencionales de cultivo selectivo o ingeniería genética y que contienen los denominados rasgos productivos (por ejemplo, mejor estabilidad en el almacenamiento, mayor valor nutritivo y mejor sabor).

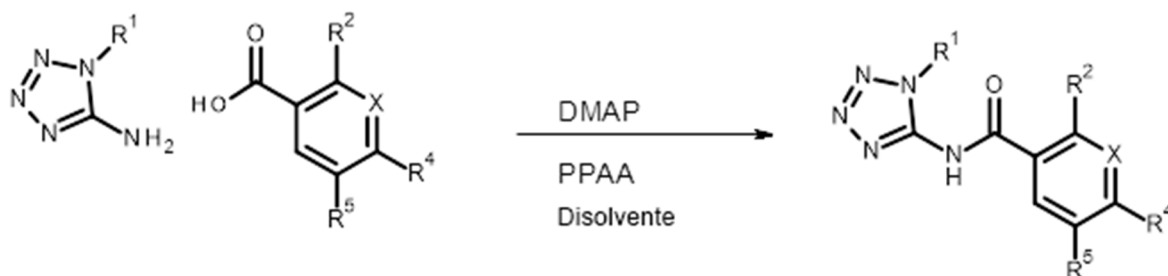
Otras plantas útiles incluyen pasto, por ejemplo, en campos de golf, praderas, parques y arcenes, o que se cultiva comercialmente para obtener césped, y plantas ornamentales tales como flores o arbustos.

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

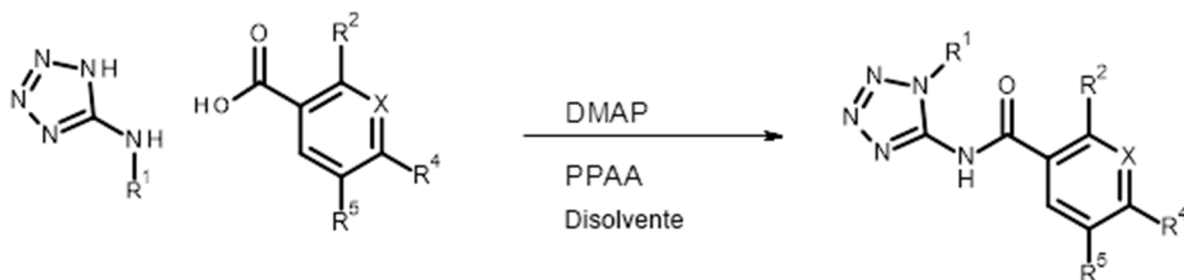
La presente divulgación proporciona el uso de un compuesto seleccionado del grupo que consiste en la fórmula (I), fórmula (Ia), fórmula (Ib), fórmula (Ic), fórmula (Ic'), fórmula (Id) y fórmula (Ie) como herbicida.

Los compuestos de la presente divulgación pueden prepararse de acuerdo con los siguientes esquemas.

**Esquema 1:-** Reacción de un ácido carboxílico activado con un 1-alkil-5-aminotetrazol:

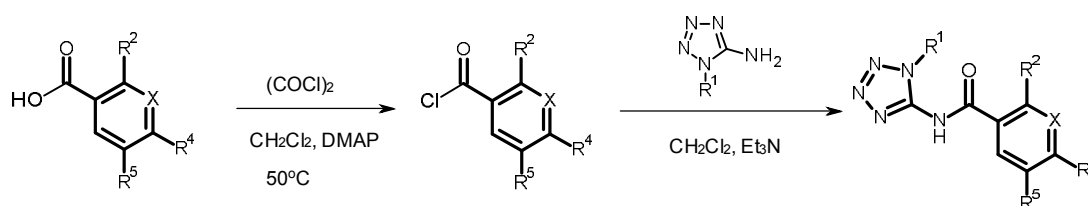


**Esquema 2:-** Reacción de un ácido carboxílico activado con un 5-(alquilamino)tetrazol:



**Esquema 3**

45



En cada caso, DMAP = 4-dimetilaminopiridina, PPAA = anhídrido cíclico del ácido 1-propanofosfónico, y el disolvente es un disolvente orgánico aprótico tal como acetato de etilo.

5

### Ejemplos

**Ejemplo 1:-** Síntesis del compuesto 1.001 (véase la tabla 1 a continuación).

10 En un matraz de fondo redondo que contiene una barra agitadora magnética se introducen ácido 2-cloro-4-metilsulfonil-3-(2,2,2-trifluoroetoximetil)benzoico (A, 1,05 equiv., 0,3674 g, 1,0596 mmol) y 1-metiltetrazol-5-amina (B, 100 mg, 0,1 g, 1,0091 mmol), después acetato de etilo (10 ml). A la suspensión blanca agitada entonces se le añade DMAP N,N-dimetilaminopiridina (2 equiv., 0,2491 g, 2,0182 mmol) y esta se agita durante 1 h antes de añadir gota a gota una solución al 50% de PPAA en EtOAc: anhídrido cíclico del ácido 1-propanofosfónico (50% en masa) en EtOAc (2 equiv., 1,28431 g, 2,0182 mmol).

15

Esta se agita a temperatura ambiente durante cinco días y después se trata añadiendo agua y EtOAc. La fase orgánica se separa, se lava con una solución acuosa 2 N de NaOH varias veces y después se lava con una solución saturada de NH<sub>4</sub>Cl hasta el pH del ácido acuoso (pH 5-6). La fase orgánica entonces se seca sobre MgSO<sub>4</sub>, se filtra y se evapora para dar, después de alto vacío, 257 mg de sólido cristalino blanco (rendimiento = 59%).

20

**Ejemplo 2:-** Síntesis del compuesto 1.005 (véase la tabla 1 a continuación).

25 En un matraz de fondo redondo que contiene una barra agitadora magnética se introducen N-metil-1H-tetrazol-5-amina (B, 25 mg, 0,025 g, 0,2523 mmol) y ácido 2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)benzoico (A, 1,1 equiv., 0,07443 g, 0,2775 mmol) seguido de 2 ml de EtOAc. Se forma rápidamente un sólido blanco fino. A la suspensión blanca agitada se le añade entonces DMAP (2 equiv., 0,06226 g, 0,5045 mmol). Después de agitar durante 15 min, se le añade gota a gota una solución al 50% de PPAA en EtOAc: anhídrido cíclico del ácido 1-propanofosfónico (50% en masa) en EtOAc (1,5 equiv., 0,2408 g, 0,3784 mmol) a temperatura ambiente. Durante el transcurso de la adición, todo se convierte en una solución. Esta se agita a temperatura ambiente durante 2 días (o hasta que quede solamente una cantidad muy pequeña de SM) y después se trata añadiendo agua y EtOAc. La fase acuosa se extrae dos veces más con EtOAc. Los extractos orgánicos se combinan, se lavan con una solución saturada de NaHCO<sub>3</sub>, después con salmuera. A continuación se seca sobre MgSO<sub>4</sub>, se filtra y el disolvente se evapora para dar 36 mg de sólido blanco. Se purifica por cromatografía usando el sistema de purificación CombiFlash Rf de Presearch en un cartucho de carga de 4 g Redisep precompactado y sólido. Se usó un gradiente de EtOAc/isohexano durante 25 min con detección UV a 254 nm. El producto se aisló como un sólido blanco (13 mg, rendimiento = 7%).

30

35

**Ejemplo 3:-** Síntesis del compuesto 1.009 (véase la tabla 1 a continuación).

40 Se añadió gota a gota cloruro de oxalilo (0,576 ml, 6,67 mmol) a una solución de ácido 5-cloro-2-trifluorometilbenzoico (500 mg, 2,23 mmol) en DCM de calidad HPLC (10 ml), que contenía DMAP. La mezcla de reacción entonces se calentó hasta 50°C durante 40 min. La masa de reacción después se enfrió hasta temperatura ambiente y el disolvente se evaporó a sequedad en una atmósfera de nitrógeno para obtener cloruro de 5-cloro-2-trifluorometilbenzoílo en bruto. La masa en bruto se disolvió en 10 ml de DCM de calidad HPLC; se añadió N-metiltetrazolamina (220 mg, 2,23 mmol) a la mezcla de reacción a 0°C. La mezcla de reacción se dejó en agitación a temperatura ambiente durante 10 min. Se añadió trietilamina (0,470 ml, 3,36 mmol) a la mezcla de reacción y la agitación se continuó durante otras 2 horas. La masa de reacción se diluyó con 50 ml de DCM y se lavó con agua (2 x 20 ml) y salmuera (1 x 10 ml). La fase orgánica se separó, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y finalmente se evaporó para obtener un material en bruto, que se purificó usando acetato de etilo-hexano para obtener 150 mg de producto puro como un sólido blanco.

45

50

**Ejemplo 4:-** Síntesis del compuesto 1.010 (véase la tabla 1 a continuación).

Se añadió gota a gota cloruro de oxalilo (1,23 ml, 14,24 mmol) a una solución de ácido 5-fluoro-2-trifluorometilbenzoico (1 g, 4,81 mmol) en DCM de calidad HPLC (15 ml), que contenía DMAP. La mezcla de reacción se calentó hasta 50°C durante 40 min. La masa de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y el disolvente se evaporó a sequedad en una atmósfera de nitrógeno para obtener cloruro de 5-fluoro-2-trifluorometilbenzoílo en bruto.

55

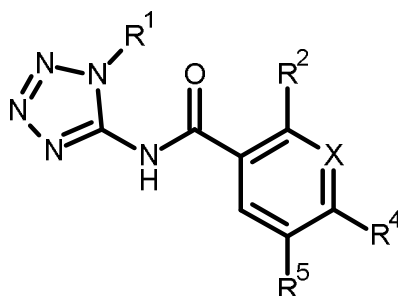
La masa en bruto se disolvió en 15 ml de DCM de calidad HPLC; se añadió N-metiltetrazolamina (476 mg, 4,81

mmol) a la mezcla de reacción a 0°C. La mezcla de reacción se dejó en agitación a temperatura ambiente durante 10 min. Se añadió trietilamina (1 ml, 7,22 mmol) a la mezcla de reacción y la agitación se continuó durante otras 3 horas. La masa de reacción se diluyó con 70 ml de DCM y se lavó con agua (2 x 20 ml) y salmuera (1 x 10 ml). La fase orgánica se separó, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y finalmente se evaporó para obtener un material en bruto, que se purificó usando acetato de etilo-hexano para obtener 170 mg de producto puro como un sólido blanco.

**Ejemplo 5:-** Síntesis del compuesto 2.002 (véase la tabla 2 a continuación).

En un matraz de fondo redondo que contenía una barra agitadora magnética se introdujo ácido 6-fluoro-7-metil-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-carboxílico (1,1 equiv., 0,07608 g, 0,2775 mmol) y N-metil-1H-tetrazol-5-amina (25 mg, 0,025 g, 0,2523 mmol). Entonces se añadió el disolvente: 2 ml de EtOAc (2 ml) y se agitó la mezcla. Se formó rápidamente un sólido blanco fino. A la suspensión se le añadió después DMAP (2 equiv., 0,06226 g, 0,5045 mmol) y precipitó un sólido blanco. A esta suspensión agitada entonces se le añadió gota a gota una solución al 50% de PPAA en EtOAc: anhídrido cíclico del ácido 1-propanfosfónico (50% en masa) en EtOAc (2 equiv., 0,3211 g, 0,5045 mmol) que son 643 µl. Se añadieron agua y EtOAc a la mezcla de reacción, que posteriormente se transfirió a un embudo de separación, entonces se extrajo dos veces más la fase acuosa con EtOAc (pH acuoso = 2). Los extractos orgánicos se combinaron, se lavaron con una solución saturada de NaHCO<sub>3</sub> (pH acuoso = 8), después con salmuera. A continuación se secó sobre MgSO<sub>4</sub>, se filtró y el disolvente se evaporó para dar 82 mg de sólido amarillo, que se comprobó por RMN.

**TABLA C1** - Ejemplos de compuestos herbicidas.

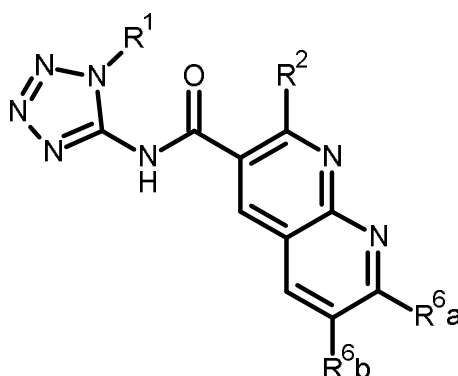


CMP	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	RMN <sup>1</sup> H (CD <sub>3</sub> OD)
1.001 CSC R119 701	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	Cl	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-S(O) <sub>2</sub> Me	H	3,29 ppm (3H, s); 4,09 ppm (3H, s); 4,18 ppm (2H, c); 5,39 ppm (2H, s); 7,92 ppm (1H, d); 8,22 ppm (1H, d).
1.002 CSC R125 896	CR <sup>3</sup>	H	Cl	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-S(O) <sub>2</sub> Me	H	3,29 ppm (3H, s); 4,18 ppm (2H, c); 5,39 ppm (2H, s); 7,87 ppm (1H, d); 8,22 ppm (1H, d).
1.003 CSC R119 732	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	-S(O) <sub>2</sub> Me	H	-CF <sub>3</sub>	H	3,41 ppm (3H, s); 4,11 ppm (3H, s); 8,06 ppm (1H, d); 8,20 ppm (1H, d); 8,38 ppm (1H, s).

CMP	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	RMN <sup>1</sup> H (CD <sub>3</sub> OD)
1.004 CSC D612 162	CR <sup>3</sup>	<i>n</i> -Pr	-Cl	H	H	Cl	
1.005 CSC R604 362	N	-CH <sub>3</sub>	-etilo	-	-CHFCH <sub>3</sub>	H	1,31 ppm (3H, t); 1,71 ppm (3H, dd); 3,07 ppm (2H, c); 4,14 ppm (3H, s, NCH <sub>3</sub> ); 5,70 ppm (1H, m); 7,49 ppm (1H, d); 8,21 ppm (1H, d).
1.006 CSC R763 920	N	-CH <sub>3</sub>	-metilo	-	-CHFCH <sub>3</sub>	H	1,70 ppm (3H, dd); 2,79 ppm (3H, s); 4,11 ppm (3H, s); 5,70 ppm (1H, m); 7,54 ppm (1H, d); 8,32 ppm (1H, d); 11,70 ppm (1H, s a, NH).
1.007 CSC R763 924	N	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-	-CHFCH <sub>3</sub>	H	1,70 ppm (3H, dd); 3,46 ppm (3H, s); 3,94 ppm (3H, s); 4,90 ppm (2H, m); 5,75 ppm (1H, m); 7,50 ppm (1H, d); 8,24 ppm (1H, d).
1.008 CSC R768 167	N	-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>2</sub> -	-	-CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,04 ppm (3H, t); 3,13 ppm (3H, s); 3,52 ppm (2H, m); 3,81 ppm (2H, m); 4,06 ppm (3H, s); 4,95 ppm (2H, s); 7,79 ppm (1H, d); 8,36 ppm (1H, d); 10,96 ppm (1H, s a).
1.009 CSC V762 264	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	(DMSO): 4,00 ppm (3H, s); 7,87 ppm (1H, d); 7,94 ppm (1H, d); 8,13 ppm (1H, s); 12,00 ppm (1H, s)
1.010 CSC V762 265	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	H	H	F	(DMSO): 3,99 ppm (3H, s); 7,65 ppm (1H, dd a); 7,92 ppm (1H, d a); 8,00 ppm (1H, dd); 11,97 (1H, s a)

CMP	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	RMN <sup>1</sup> H (CD <sub>3</sub> OD)
1.011 CSC V762 266	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	-NO <sub>2</sub>	H	F	F	(DMSO)4,02 ppm (3H, s); 8,21 ppm (1H, dd); 8,51 ppm (1H, dd); 12,05 ppm (1H, s a)
1.012 CSC V762 267	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	F	H	Cl	Br	(DMSO)3,94 ppm (3H, s); 7,90 ppm (1H, d); 8,24 ppm (1H, d); 11,73 ppm (1H, s a)
1.013 CSC V762 268	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	-NO <sub>2</sub>	H	H	- C H <sub>3</sub>	(DMSO)2,50 ppm (3H, s); 4,02 ppm (3H, s); 7,62 ppm (d a); 7,72 ppm (1H, s a); 8,14 ppm (1H, d); 11,90 ppm (1H, s a)
1.014 CSC V762 269	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	H	H	- C H <sub>3</sub>	(DMSO)2,48 ppm (3H, s); 3,98 ppm (3H, s); 7,58 ppm (1H, d a); 7,71 ppm (s a); 7,77 ppm (1H, d a); 11,83 ppm (1H, s a)
1.015 CSA A912 582	CR <sup>3</sup>	-CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	H	
1.016 CSC D763 931	CR <sup>3</sup>	<i>n</i> -propilo	Cl	Cl	H	H	

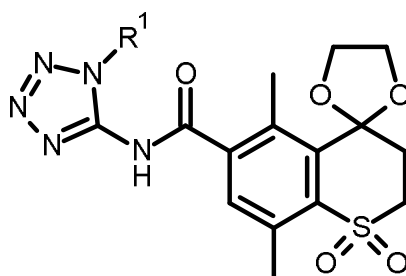
**TABLA C2** - Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.





Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	RMN <sup>1</sup> H (CD <sub>3</sub> OD)
2.001 <u>CSCR125991</u>	H	-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> O-	H	4,19 ppm (3H, s); 7,32 ppm (1H, d); 8,41 ppm (1H, d); 8,79 ppm (1H, s).
2.002 CSCR119703	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	F	2,89 ppm (3H, d); 4,08 ppm (3H, s); 8,27 ppm (1H, d); 8,93 ppm (1H, s).
2.003 CSCR119704	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> O-	2,71 ppm (3H, s); 4,08 ppm (6H, m); 7,82 ppm (1H, s); 8,77 ppm (1H, s).

TABLA C3 - Ejemplos de compuestos herbicidas.



5

Compuesto	R <sup>1</sup>	RMN <sup>1</sup> H (CD <sub>3</sub> OD)
3.001 <u>CSCR120508</u>	H	2,48 (3H, s, CH <sub>3</sub> ); 2,60 ppm (2H, m, CH <sub>2</sub> ); 2,73 ppm (3H, s, CH <sub>3</sub> ); 3,52 ppm (2H, m, CH <sub>2</sub> ); 4,21 ppm (2H, m, CH <sub>2</sub> ); 4,31 ppm (2H, m, CH <sub>2</sub> ); 7,49 ppm (1H, s, CH aromático).

## Ejemplos biológicos

- 10 Se siembran semillas de una diversidad de especies de ensayo en suelo convencional en recipientes (*Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Setaria faberi* (SETFA), *Stellaria media* (STEME), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE)). Tras cultivarlas durante un día (preemergencia) o tras cultivarlas durante 8 días (posemgerencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizan con una solución acuosa de pulverización derivada de la formulación del principio activo técnico en una solución de acetona/agua (50:50) que contiene un 0,5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxi-etileno, n.º de reg. CAS 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 1000 g/h. Las plantas de ensayo entonces se cultivan en un invernadero
- 15

## ES 2 659 553 T3

en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se riegan dos veces al día. Después de 13 días para la pre- y posemergencia, la prueba se evalúa con el fin de determinar el porcentaje de daños provocados en la planta. Las actividades biológicas se muestran en la siguiente tabla en una escala de cinco puntos (5 = 80-100%, 4 = 60-79%, 3 = 40-59%, 2 = 20-39%, 1 = 0-19%).

5

Compuesto	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
1.001	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.003	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.004	5	4	1	1	1	5	4	5	1	1	1	1
1.005	5	5	2	2	5	5	5	5	3	3	5	5
1.008	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.009	5	5	1	5	2	5	5	5	1	5	2	4
1.010	5	5	2	5	4	5	5	5	2	5	4	5
1.011	2	3	1	1	2	2	1	5	1	1	1	1
1.012	4	5	4	2	3	5	1	4	1	1	1	1
1.013	5	4	1	2	1	5	5	5	2	2	1	4
1.014	5	5	1	3	3	5	5	5	1	4	3	4

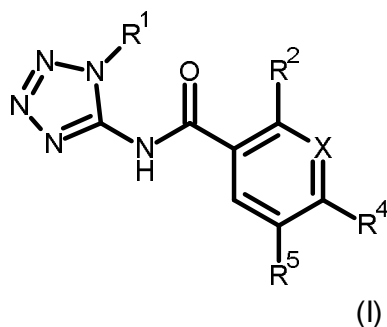
**Tabla B1**

Compuesto	POSaplicación				PREaplicación			
	AMARE	LOLPE	STEME	DIGSA	AMARE	LOLPE	STEME	DIGSA
1.002	5	1	2	1	5	1	1	1
1.006	5	5	5	5	5	4	4	4
1.007	5	2	5	5	5	1	4	3
1.015	4	4	4	1	5	3	3	1
1.016	3	1	1	1	4	1	2	1
2.001	3	1	3	1	1	1	1	1
2.002	5	2	5	4	5	2	3	3
2.003	5	2	5	4	5	1	1	1

**Tabla B2**

REIVINDICACIONES

1. Un método de control de malezas en un emplazamiento, comprendiendo dicho método la aplicación al emplazamiento de una maleza de una cantidad de control de una composición herbicida que comprende un compuesto de fórmula (Ia):



o una sal agronómicamente aceptable del mismo, donde:-

R<sup>1</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub> y alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-3</sub>;

R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquilC<sub>1-6</sub>-, haloalquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-3</sub>-alcoxiC<sub>2-3</sub>-alquilC<sub>1-3</sub>-, halógeno, ciano, nitro, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-;

X es CR<sup>3</sup> o N;

R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alcoxiC<sub>1-6</sub>, alquilaminoC<sub>1-6</sub>, dialquilaminoC<sub>1-6</sub>-, piperidino, morfolino, ciano, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-;

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> juntos forman un anillo aromático de 5 o 6 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo de nitrógeno, estando el anillo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>6</sup>;

R<sup>6</sup> se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>-alquiloC<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-6</sub> y haloalcoxiC<sub>1-6</sub>; y

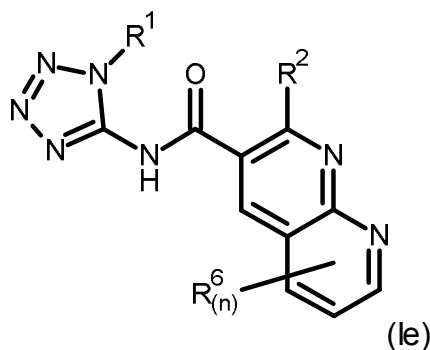
p = 0, 1 o 2.

2. Un método de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1-6</sub> y R<sup>2</sup> se selecciona del grupo que consiste en alquilC<sub>1-6</sub>-, haloalquilC<sub>1-6</sub>-, alcoxiC<sub>1-6</sub>-alquilC<sub>1-6</sub>-, halógeno, ciano, nitro, alquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>- y haloalquilC<sub>1-6</sub>-S(O)<sub>p</sub>-.

3. Un método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones previas, donde X es CR<sup>3</sup>.

4. Un compuesto de fórmula (I) como se define en la reivindicación 1.

5. Un compuesto de la reivindicación 4, que es de fórmula (Ie)



donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>6</sup> son como se definen en la reivindicación 1 o reivindicación 2, y n = 0, 1, 2 o 3.

6. Una composición herbicida que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 o reivindicación 5 y un adyuvante de formulación agronómicamente aceptable.
- 5 7. Una composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 6, donde la composición herbicida comprende además al menos un pesticida adicional.
8. Una composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 7, donde el pesticida adicional es un herbicida y/o un protector de herbicida.
- 10 9. Un método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde la composición herbicida comprende además al menos un pesticida adicional.
- 15 10. Un método de acuerdo con la reivindicación 9, donde el pesticida adicional es un herbicida y/o un protector de herbicida.
11. El uso de un compuesto de fórmula (I) como se define en la reivindicación 1 como herbicida.