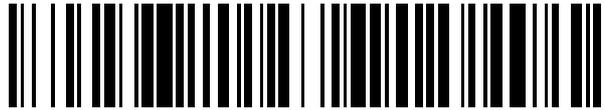


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 542 681**

51 Int. Cl.:

C07D 249/14 (2006.01)

C07D 257/06 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

A01N 43/653 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.07.2012 E 12745447 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.05.2015 EP 2739611**

54 Título: **Amidas del ácido N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico y su uso como herbicidas**

30 Prioridad:

03.08.2011 EP 11176378

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

10.08.2015

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Str. 10
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**BRAUN, RALF;
DÖRNER-RIEPING, SIMON;
KÖHN, ARNIM;
AHRENS, HARTMUT;
LEHR, STEFAN;
VAN ALMSICK, ANDREAS;
HÄUSER-HAHN, ISOLDE;
DIETRICH, HANSJÖRG;
GATZWEILER, ELMAR;
HEINEMANN, INES y
ROSINGER, CHRISTOPHER, HUGH**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 542 681 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).

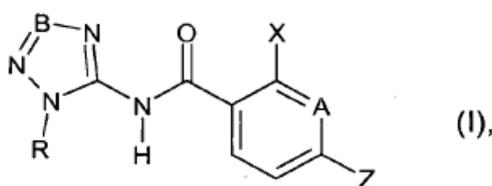
DESCRIPCIÓN

Amidas del ácido N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico y su uso como herbicidas

La invención se refiere al campo técnico de los herbicidas, en particular al campo de los herbicidas para combatir de manera selectiva malas hierbas y malezas en cultivos de plantas útiles.

5 Por el documento WO2003/010143 y el documento WO2003/010153 se conocen N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)benzamidas y su efecto farmacológico. Por el documento no publicado previamente, de prioridad anterior, EP101748937 se conocen determinadas N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)benzamidas y -nicotinamidas como herbicidas. Se descubrió ahora que amidas y nicotinamidas de ácido (tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico, que portan sustituyentes especiales en posición 1 del anillo de tetrazol o de triazol, son especialmente adecuadas como herbicidas.

Un objeto de la presente invención son por lo tanto amidas del ácido N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico de fórmula (I) o sus sales



en la que

15 A significa N o CY,

B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, formilo, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, estando los dos restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo,

Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₃-C₆), halo-(C₁-C₆)-cicloalquilo, cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-CN, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, alquil (C₁-C₆)-fenilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, estando los 6 últimos restos en cada caso con s restos del grupo halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

Z significa halógeno, ciano, rodano, halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, heteroarilo, heterociclilo o fenilo, estando los tres últimos restos sustituidos en cada caso con s restos del grupo halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆) o halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo, o

Z puede significar también hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxilo (C₁-C₆), en caso de que Y represente el resto S(O)_nR₂.

R significa CH₂R⁶, heterociclilo CH₂ sustituido con m grupos oxo,

- cicloalquilo (C₃-C₇) sustituido con t grupos alquilo (C₁-C₆), alquilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halo-alquilo (C₂-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆) o halo-alquinilo (C₂-C₆) sustituido en cada caso con u restos del grupo que consiste en nitro, ciano, hidroxilo, oxo, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, estando sustituidos los restos cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo en cada caso con s sustituyentes del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxilo, ciano, nitro, trifluorometilo y halógeno, y portando heterociclilo y cicloalquilo n grupos oxo,
- Q significa O, S o NR³,
- 10 R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo estando sustituidos los 21 restos mencionados en último lugar con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, rodano, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₂-C₆)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 15 R² significa alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo estando sustituidos los 21 restos mencionados en último lugar con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, rodano, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₂-C₆)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 20 R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆),
- R⁴ significa alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆),
- R⁵ significa alquilo (C₁-C₄),
- 30 R⁶ significa OCOOR⁴, NR⁴COOR⁴, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, heterociclilo o cicloalquilo, portando los dos restos mencionados en último lugar m grupos oxo o hidroxilo,
- m significa 1 o 2,
n significa 0, 1 o 2,
s significa 0, 1, 2 o 3,
35 t significa 1, 2, 3 o 4,
u significa 1, 2, 3, 4 o 5.

En la fórmula (I) y todas las fórmulas siguientes los restos alquilo con más de dos átomos de carbono pueden ser de cadena lineal o ramificados. Los restos alquilo significan por ejemplo metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, t- o 2-butilo, pentilos, hexilos, tal como n-hexilo, i-hexilo y 1,3-dimetilbutilo. De manera análoga alquenilo significa por ejemplo alilo, 1-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metil-prop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metil-but-3-en-1-ilo y 1-metil-but-2-en-1-ilo. Alquinilo significa por ejemplo propargilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 1-metil-but-3-in-1-ilo. El enlace múltiple puede encontrarse en cada caso en cualquier posición del resto insaturado. Cicloalquilo significa un sistema de anillo saturado, carbocíclico con tres a seis átomos de C, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo. De manera análoga, cicloalquenilo significa un grupo alquenilo monocíclico con tres a seis miembros de anillo carbonado, por ejemplo ciclopropenilo, ciclobutenilo, ciclopentenilo y ciclohexenilo, pudiendo encontrarse el doble enlace en cualquier posición.

40

45

Halógeno representa flúor, cloro, bromo o yodo.

Heterociclilo significa un resto cíclico saturado, parcialmente saturado o completamente insaturado, que contiene de 3 a 6 átomos de anillo, de los que de 1 a 4 proceden del grupo oxígeno, nitrógeno y azufre, y que adicionalmente puede estar hibridado con un anillo benzoico. Por ejemplo heterociclilo representa piperidinilo, pirrolidinilo, tetrahidrofurano, dihidrofurano y oxetano. Heteroarilo significa un resto cíclico aromático, que contiene de 3 a 6 átomos de anillo, de los que de 1 a 4 proceden del grupo oxígeno, nitrógeno y azufre, y que adicionalmente puede estar hibridado con un anillo benzoico. Por ejemplo heteroarilo representa bencimidazol-2-ilo, furano, imidazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, piridinilo, bencisoxazolilo, tiazolilo, pirroliilo, pirazolilo, tiofenilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,5-triazolilo, 1,3,4-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 2H-1,2,3,4-tetrazolilo, 1H-1,2,3,4-tetrazolilo, 1,2,3,4-oxatriazolilo, 1,2,3,5-oxatriazolilo, 1,2,3,4-tiatrizolilo

50

55

y 1,2,3,5-tiazolillo.

Si un grupo está sustituido varias veces con restos, entonces ha de entenderse con ello que este grupo está sustituido con uno o varios de los restos mencionados iguales o diferentes.

5 Los compuestos de fórmula general (I), según el tipo y la unión de los sustituyentes, pueden encontrarse como estereoisómeros. Si están presentes por ejemplo uno o varios átomos de carbono asimétricos, entonces pueden aparecer enantiómeros y diastereómeros. Así mismo aparecen estereoisómeros cuando n representa 1 (sulfóxidos). Pueden obtenerse estereoisómeros a partir de las mezclas que se producen durante la preparación de acuerdo con métodos de separación habituales, por ejemplo mediante procedimientos de separación cromatográfica. Así mismo pueden prepararse de manera selectiva estereoisómeros mediante el uso de reacciones estereoselectivas con el uso de adyuvantes y/o materiales de partida ópticamente activos. La invención se refiere también a todos los estereoisómeros y sus mezclas, que están comprendidos por la fórmula general (I), aunque no estén específicamente definidos.

Se prefieren compuestos de fórmula general (I), en la que

A significa N o CY,

15 B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹ o alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, estando los dos restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo,

25 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, COOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquil (C₁-C₆)-fenilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, estando los seis restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos del grupo halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

35 Z significa halógeno, ciano, rodano, halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, C(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², 1,2,4-triazol-1-ilo, o

40 Z puede significar también hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxilo (C₁-C₆), en caso de que Y represente el resto S(O)_nR₂.

R significa CH₂R⁶, heterociclilo CH₂ sustituido con m grupos oxo,

45 alquilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halo-alquilo (C₂-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o halo-alquino (C₂-C₆) sustituido en cada caso con u restos del grupo que consiste en nitro, ciano, hidroxilo, oxo, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, estando sustituidos los restos cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo en cada caso con s sustituyentes del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxilo, ciano, nitro, trifluorometilo y halógeno, y portando heterociclilo y cicloalquilo n grupos oxo,

Q significa O, S o NR³,

55 R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₂), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, estando los 16 restos mencionados en último lugar sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³,

$\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, CO_2R^3 , $\text{CON}(\text{R}^3)_2$ y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_2\text{-C}_6$)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

5 R^2 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), fenilo, fenil-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heteroarilo, heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heteroarilo o alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heterociclilo, estando estos restos sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR^3 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^4$, $\text{N}(\text{R}^3)_2$, NR^3OR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, COR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , CO_2R^3 , $\text{CON}(\text{R}^3)_2$ y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_2\text{-C}_6$)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

R^3 significa hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$) o cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$),

10 R^4 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) o alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$),

R^5 significa metilo o etilo,

R^6 significa OCOR^4 , NR^4COOR^4 , $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), nitro, ciano, SiR^5_3 , $\text{PO}(\text{OR}^5)_2$ o heterociclilo, que porta m grupos oxo,

15 m significa 1 o 2,

n significa 0, 1 o 2,

s significa 0, 1, 2 o 3,

u significa 1, 2, 3, 4 o 5.

Se prefieren especialmente compuestos de fórmula general (I), en la que

A significa N o CY,

20 B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), OR^1 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OR^1 , alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{CON}(\text{R}^1)_2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^1COR^1 , alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heterociclilo, estando los dos restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), y portando heterociclilo n grupos oxo,

30 Y hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), OR^1 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, $\text{N}(\text{R}^1)_2$, $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, NR^1COR^1 , alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OR^1 , alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{CON}(\text{R}^1)_2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^1COR^1 , alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-fenilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, estando los 6 últimos restos en cada caso con s restos del grupo halógeno, nitro, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$) y cianometilo, y portando heterociclilo grupos oxo,

Z significa halógeno, ciano, halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, 1,2,4-triazol-1-ilo, o Z puede significar también hidrógeno, metilo, metoxilo o etoxilo, en caso de que Y represente el resto $\text{S}(\text{O})_n\text{R}_2$,

35 R significa CH_2R^6 , CH_2 -heterociclilo, portando heterociclilo m grupos oxo, alquilo ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), halo-alquilo ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), halo-alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$) o halo-alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$) sustituido en cada caso con u restos del grupo que consiste en nitro, ciano, hidroxilo, oxo, SiR^5_3 , $\text{PO}(\text{OR}^5)_2$, $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{N}(\text{R}^3)_2$, COR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, estando sustituidos los restos cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo en cada caso con s sustituyentes del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxilo, ciano, nitro, trifluorometilo y halógeno, y portando heterociclilo y cicloalquilo n grupos oxo,

Q significa O, S o NR^3 ,

45 R^1 significa hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), fenilo, fenil-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heteroarilo, heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heteroarilo o alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heterociclilo, estando los 16 restos mencionados en último lugar sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR^3 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^4$, $\text{N}(\text{R}^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, CO_2R^3 , $\text{CON}(\text{R}^3)_2$ y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_2\text{-C}_6$)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

50 R^2 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$) o cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), estando estos tres restos mencionados anteriormente sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en halógeno y OR^3 ,

R^3 significa hidrógeno o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$),

R⁴ significa alquilo (C₁-C₆),

R⁵ significa metilo o etilo,

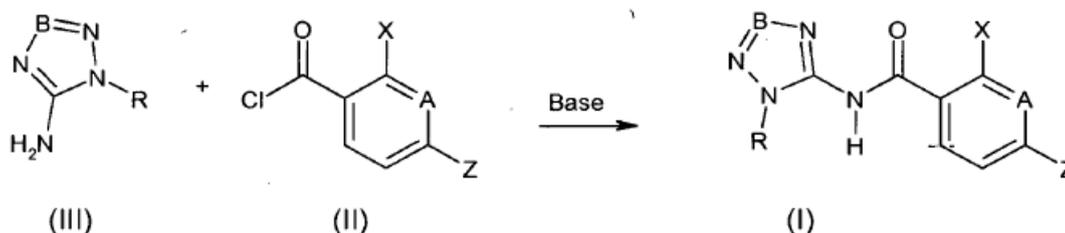
R⁶ significa OCOOR⁴, NR⁴COOR⁴, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂,

- 5 m significa 1 o 2,
 n significa 0, 1 o 2,
 s significa 0, 1, 2 o 3,
 u significa 1, 2, 3, 4 o 5.

10 En todas las fórmulas mencionadas a continuación, sustituyentes y símbolos, siempre que no se defina lo contrario, tienen el mismo significado que se describe en la fórmula (I).

Compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el método indicado en el esquema 1 mediante reacción catalizada con base de un cloruro de ácido benzoico (II) con un 5-amino-1-H-1,2,4-triazol, o 5-amino-1H-tetrazol (III):

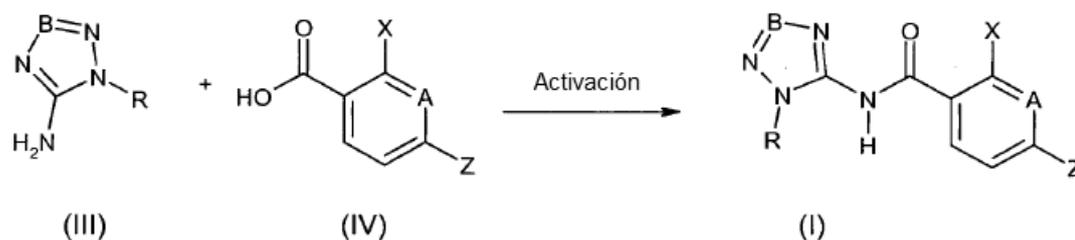
Esquema 1



15 Los cloruros de ácido benzoico de fórmula (II) o los ácidos benzoicos en los que se basan son en principio conocidos y pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con los métodos descritos en los documentos US 6.376.429 B1, EP 1 585 742 A1 y EP 1 202 978 A1.

20 Compuestos de acuerdo con la invención, pueden prepararse también de acuerdo con el método indicado en el esquema 2 mediante reacción de un ácido benzoico de fórmula (IV) con un 5-amino-1-H-1,2,4-triazol, o 5-amino-1H-tetrazol (III):

Esquema 2



Para la activación pueden usarse reactivos deshidratantes, que se usan habitualmente para reacciones de amidación, tal como por ejemplo 1,1'-carbonildiimidazol (CDI), dicitclohexilcarbodiimida (DCC), 2,4,6-tripropil-1,3,5,2,4,6-trioxatrisfosfina 2,4,6-trióxido (T3P) etc.

25 Compuestos de acuerdo con la invención, pueden prepararse también de acuerdo con el método indicado en el esquema 3 mediante reacción de una N-(1H-1,2,4-triazol-5-il)benzamida, N-(1H-tetrazol-5-il)benzamida, N-(1H-1,2,4-triazol-5-il)nicotinamidas o N-(1H-tetrazol-5-il)nicotinamidas:

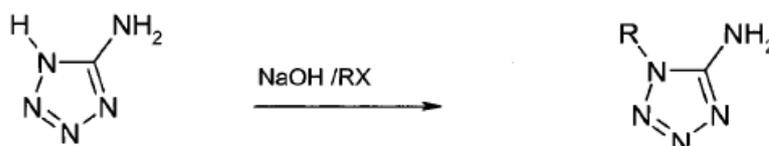
Esquema 3



Para esta reacción mencionada en el esquema 3 pueden usarse agentes de alquilación, tal como halogenuros, sulfonatos de alquilo, o dialquilsulfatos en presencia de una base.

- 5 Puede ser conveniente cambiar el orden de las etapas de reacción. De este modo, ácidos benzoicos, que portan un sulfóxido, no pueden convertirse sin más en sus cloruros de ácido. En este caso se ofrece, preparar en primer lugar en la etapa de tioéter la amida y después oxidar el tioéter para dar sulfóxido.

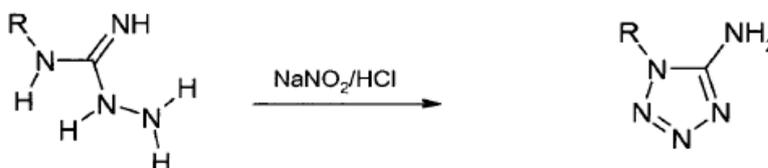
Los 5-amino-1H-tetrazoles de fórmula (III) pueden prepararse de manera análoga a métodos conocidos en la bibliografía. Por ejemplo pueden prepararse 5-amino-1-R-tetrazoles de acuerdo con el método descrito en Journal of the American Chemical Society (1954), 76, 923-924 a partir de amino-tetrazol:



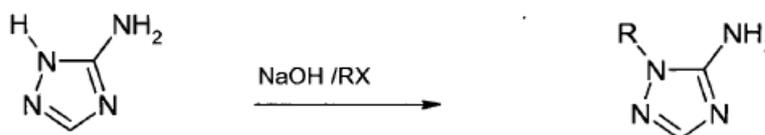
10

En la fórmula mencionada anteriormente R representa por ejemplo un resto alquilo.

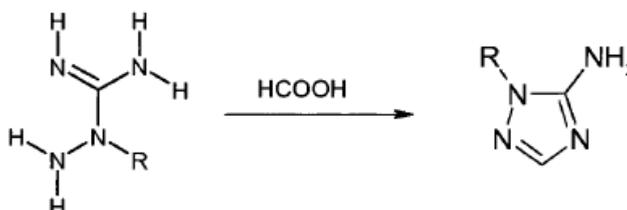
5-Amino-1-R-tetrazoles pueden sintetizarse por ejemplo tal como se describe en Journal of the American Chemical Society (1954) 76, 88-89:



- 15 Los 5-amino-1H-triazoles de fórmula (III) pueden prepararse de manera análoga a métodos conocidos de la bibliografía. Por ejemplo pueden prepararse 5-amino-1-R-triazoles de acuerdo con el método descrito en Zeitschrift für Chemie (1990), 30(12), 436 - 437 a partir de aminotriazol:

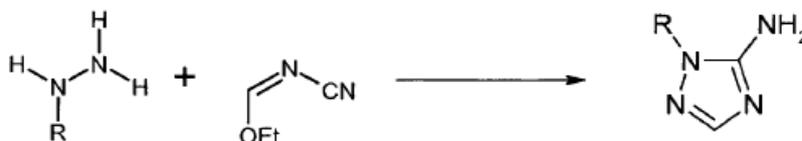


- 20 5-Amino-1-R-triazoles pueden sintetizarse también por ejemplo tal como se describe en Chemische Berichte (1964), 97(2), 396-404:



5-Amino-1-R-triazoles pueden sintetizarse también por ejemplo tal como se describe en Angewandte Chemie (1963),

75, 918:



5 Colecciones de compuestos de fórmula (I) y/o sus sales, que pueden sintetizarse de acuerdo con las reacciones mencionadas anteriormente, pueden también prepararse de manera paralela, produciéndose esto de manera manual, parcialmente automatizada o totalmente automatizada. A este respecto es por ejemplo posible automatizar la realización de la reacción, el tratamiento o la purificación de los productos o etapas intermedias. En conjunto se entiende con esto un modo de proceder tal como se describe por ejemplo por D. Tiebes in *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor Günther Jung), Verlag Wiley 1999, en las páginas 1 a 34.

10 Para la realización de la reacción paralela y el tratamiento pueden usarse una serie de aparatos disponibles en el mercado, por ejemplo bloques de reacciones Calypso (*Calypso reaction blocks*) de la empresa Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EE. UU. o estaciones de reacción (*reaction stations*) de la empresa Radleys, Shirehill, Saffron Waiden, Essex, CB 11 3AZ, Inglaterra o MultiPROBE Automated Workstations de la empresa Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, EE. UU. Para la purificación paralela de compuestos de fórmula general (I) y sus sales o de productos intermedios que se producen durante la preparación se encuentran disponibles entre otros, aparatos de cromatografía, por ejemplo de la empresa ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE. UU.

15 Los aparatos mencionados conducen a un modo de proceder modular, en el que las etapas de trabajo individuales están automatizadas, debiendo realizarse sin embargo operaciones manuales entre las etapas de trabajo. Esto puede evitarse mediante el uso de sistemas de automatización parcial o totalmente integrados, en los que los módulos de automatización respectivos se accionan por ejemplo mediante robot. Los sistemas de automatización de este tipo pueden adquirirse por ejemplo de la empresa Caliper, Hopkinton, MA 01748, EE. UU.

20 La realización de etapas de síntesis individuales o varias puede apoyarse mediante el uso de resinas-eliminadores/reactivos soportados por polímero. En la bibliografía técnica se describen una serie de protocolos de ensayo, por ejemplo en *ChemFiles*, Vol. 4, N° 1, *Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis* (Sigma-Aldrich).

25 Además de los métodos descritos en el presente documento, la preparación de compuestos de fórmula general (I) y sus sales puede realizarse completa o parcialmente mediante métodos soportados en fase sólida. Para este fin se unen etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o una síntesis adaptada para el modo de proceder correspondiente a una resina sintética. Métodos de síntesis soportados por fase sólida se describen suficientemente en la bibliografía técnica, por ejemplo Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998 y *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor Günther Jung), Verlag Wiley, 1999. El uso de métodos de síntesis soportados por fase sólida permite una serie de protocolos conocidos en la bibliografía que pueden realizarse, a su vez, de forma manual o automatizada. Las reacciones pueden realizarse por ejemplo por medio de tecnología IRORI en microrreactores (*microreactors*) de la empresa Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EE. UU.

30 La realización de etapas de síntesis individuales o varias puede soportarse tanto en fase sólida como en fase líquida mediante el uso de la tecnología de microondas. En la bibliografía técnica se describen una serie de protocolos de ensayo, por ejemplo en *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry* (editor C. O. Kappe y a. Stadler), Verlag Wiley, 2005.

35 La preparación de acuerdo con el procedimiento descrito en el presente documento proporciona compuestos de fórmula (I) y sus sales en forma de colecciones de sustancias, que se denominan bibliotecas. Objeto de la presente invención son también bibliotecas que contienen al menos dos compuestos de fórmula (I) y sus sales.

40 Los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) (y/o sus sales), a continuación denominados conjuntamente como "compuestos de acuerdo con la invención", presentan una eficacia herbicida excelente contra un amplio espectro de plantas nocivas anuales mono- y dicotiledóneas importantes. Así mismo plantas nocivas perennes que se combaten con dificultad, que crecen a partir de rizomas, tocones de raíz u otros órganos permanentes, se detectan bien por los principios activos.

45 Por tanto es también objetivo de la presente invención un procedimiento para combatir plantas indeseadas o para la regulación del crecimiento de plantas, preferentemente en cultivos vegetales, en los que se esparcen uno o varios compuesto(s) de acuerdo con la invención sobre las plantas (por ejemplo plantas nocivas tales como malas hierbas mono- o dicotiledóneas o plantas de cultivo indeseadas), las semillas (por ejemplo granos, semillas u órganos reproductores vegetativos tales como tubérculos o partes de brotes con yemas) o la superficie sobre la que crecen las plantas (por ejemplo la superficie de cultivo). A este respecto, los compuestos de acuerdo con la invención

pueden esparcirse por ejemplo en procedimientos antes de la siembra (opcionalmente también mediante la introducción en la tierra), de preemergencia o de postemergencia. En detalle se mencionan a modo de ejemplo algunos representantes de la flora de malas hierbas mono- y dicotiledóneas que pueden controlarse mediante los compuestos de acuerdo con la invención, sin que mediante la mención deba realizarse una limitación a determinadas especies.

5 Plantas nocivas monocotiledóneas de los géneros: *Aegilops*, *Agropyron*, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Commelina*, *Cynodon*, *Cyperus*, *Dactiloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Eragrostis*, *Eriochloa*, *Festuca*, *Fimbristilis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sorghum*.

10 Malas hierbas dicotiledóneas de los géneros: *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Anoda*, *Anthemis*, *Aphanes*, *Artemisia*, *Atriplex*, *Bellis*, *Bidens*, *Capsella*, *Carduus*, *Cassia*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum*, *Euphorbia*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Galium*, *Hibiscus*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Lamium*, *Lepidium*, *Lindernia*, *Matricaria*, *Mentha*, *Mercurialis*, *Mullugo*, *Myosotis*, *Papaver*, *Pharbitis*, *Plantago*, *Poligonum*, *Portulaca*, *Ranunculus*, *Raphanus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex*, *Salsola*, *Senecio*, *Sesbania*, *Sida*, *Sinapis*,
15 *Solanum*, *Sonchus*, *Sphenoclea*, *Stellaria*, *Taraxacum*, *Thlaspi*, *Trifolium*, *Urtica*, *Veronica*, *Viola*, *Xanthium*.

Si los compuestos de acuerdo con la invención se aplican antes de la germinación sobre la superficie de la tierra, entonces se impide completamente la emergencia de brotes de malas hierbas o las malas hierbas crecen hasta el estadio de cotiledones, pero entonces detienen su crecimiento y por último mueren completamente al cabo de tres a cuatro semanas.

20 Con la aplicación de los principios activos sobre las partes verdes de las plantas en el procedimiento postemergencia, tras el tratamiento se produce una parada del crecimiento y las plantas nocivas permanecen en el estadio de crecimiento existente en el momento de la aplicación o mueren tras un cierto tiempo, de modo que de esta manera se elimina una competencia de malas hierbas nocivas para las plantas de cultivo de manera muy temprana y duradera.

25 Aunque los compuestos de acuerdo con la invención presentan una actividad herbicida excelente frente a malas hierbas mono- y dicotiledóneas, las plantas de cultivo de cultivos de importancia económica por ejemplo de cultivos de dicotiledóneas de los géneros *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*, o cultivos de monocotiledóneas de los géneros *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*,
30 *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, en particular *Zea* y *Triticum*, en función de la estructura del compuesto de acuerdo con la invención respectivo y su cantidad de aplicación se dañan sólo de manera insignificante o no se dañan en absoluto. Los presentes compuestos son bastante adecuados por estos motivos para combatir de manera selectiva el crecimiento de plantas indeseadas en cultivos vegetales tales como plantaciones agrícolas útiles o plantaciones ornamentales.

35 Además los compuestos de acuerdo con la invención (en función de su estructura y de la cantidad de aplicación) presentan excelentes propiedades de regulación del crecimiento en plantas de cultivo. Éstos intervienen de manera reguladora en el metabolismo propio de las plantas y pueden por lo tanto usarse para influir de forma controlada en el contenido de las plantas y para facilitar la cosecha tal como por ejemplo desencadenando desecación y contracción del crecimiento. Además son también adecuados para el control general y la inhibición del crecimiento vegetativo indeseado, sin matar a este respecto las plantas. Una inhibición del crecimiento vegetativo desempeña un gran papel en muchos cultivos de mono- y dicotiledóneas, dado que por ejemplo de este modo puede reducirse o evitarse completamente la formación de depósitos.

45 Debido a sus propiedades herbicidas y reguladoras del crecimiento de las plantas, los principios activos pueden usarse también para combatir plantas nocivas en cultivos de plantas modificadas mediante ingeniería genética o mediante mutagénesis convencional. Las plantas transgénicas se caracterizan por regla general por propiedades ventajosas especiales, por ejemplo por resistencias frente a determinados pesticidas, sobre todo determinados herbicidas, resistencias frente a enfermedades de las plantas o agentes patógenos de enfermedades de plantas tales como determinados insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales se refieren por ejemplo al producto de cosecha en cuanto a la cantidad, calidad, capacidad de almacenamiento, composición y contenido especial. Así se conocen plantas transgénicas con un contenido en almidón elevado o calidad modificada del almidón o aquellas con otra composición de ácido graso del producto de cosecha.

55 Con respecto a cultivos transgénicos se prefiere la aplicación de los compuestos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos de importancia económica de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisante y otras clases de hortalizas. Preferentemente los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse como herbicidas en cultivos de plantas útiles, que son resistentes frente a los efectos fitotóxicos de los herbicidas o que se han hecho resistentes mediante ingeniería genética.

Se prefiere la aplicación de los compuestos de acuerdo con la invención o sus sales en cultivos transgénicos de importancia económica de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisante y otras clases de hortalizas. Preferentemente los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse como herbicidas en cultivos de plantas útiles, que son resistentes frente a los efectos fitotóxicos de los herbicidas o que se han hecho resistentes mediante ingeniería genética.

Vías convencionales para la producción de nuevas plantas que, en comparación con las plantas existentes hasta ahora, presentan propiedades modificadas, consisten por ejemplo en procedimientos de cultivo clásico y la generación de mutantes. Alternativamente pueden generarse nuevas plantas con propiedades modificadas con ayuda de procedimientos de ingeniería genética (véanse por ejemplo los documentos EP-A-0221044, EP-A-0131624). Se describieron por ejemplo en varios casos

- modificaciones por ingeniería genética de plantas de cultivo con el fin de la modificación del almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),
- plantas de cultivo transgénicas, que son resistentes contra determinados herbicidas del tipo glufosinatos (véanse por ejemplo los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o glifosatos (documento WO 92/00377) o de las sulfonilureas (documentos EP-A-0257993, US-A-5013659),
- plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt), que hacen resistentes a las plantas contra determinadas plagas (documentos EP-A-0142924, EP-A-0193259).
- plantas de cultivo transgénicas con composición de ácido graso modificada (documento WO 91/13972).
- plantas de cultivo modificadas mediante ingeniería genética con nuevas sustancias contenidas o productos secundarios por ejemplo nuevas fitoalexinas, que provocan una elevada resistencia a enfermedades (documentos EPA 309862, EPA0464461)
- plantas modificadas mediante ingeniería genética con fotorrespiración reducida, que presentan mayores rendimientos de cosecha y mayor tolerancia al estrés (documento EPA 0305398).
- plantas de cultivo transgénicas, que producen proteínas importantes desde el punto de vista farmacéutico o de diagnóstico ("*molecular pharming*")
- plantas de cultivo transgénicas, que se caracterizan por mayores rendimientos de cosecha o mejor calidad
- plantas de cultivo transgénicas que se caracterizan por una combinación por ejemplo de las nuevas propiedades mencionadas anteriormente ("*gene stacking*").

En principio se conocen numerosas técnicas de biología molecular, con las que pueden producirse nuevas plantas transgénicas con propiedades modificadas; véase por ejemplo I. Potrykus y G. Spangenberg (eds.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg, o Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Para manipulaciones de ingeniería genética de este tipo pueden incorporarse moléculas de ácido nucleico en plásmidos, que permiten una mutagénesis o una modificación de secuencia mediante recombinación de secuencias de ADN. Con ayuda de procedimientos convencionales pueden efectuarse por ejemplo intercambios de bases, eliminarse secuencias parciales o añadirse secuencias naturales o sintéticas. Para la unión de los fragmentos de ADN entre sí pueden colocarse en los fragmentos adaptadores o ligadores, véase por ejemplo Sambrook y col., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2ª ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene and Klone", VCH Weinheim 2ª edición 1996.

La producción de células vegetales con una actividad reducida de un producto génico puede conseguirse por ejemplo mediante la expresión de al menos un ARN antisentido correspondiente, de un ARN sentido para obtener un efecto de cosupresión o la expresión de al menos un ribozima construido de manera correspondiente, que divide específicamente transcritos del producto génico mencionado anteriormente. Para ello pueden usarse por un lado moléculas de ADN, que presentan la secuencia codificante completa de un producto génico incluyendo secuencias flanqueantes posiblemente existentes, como también moléculas de ADN, que sólo presentan partes de la secuencia codificante, debiendo ser estas partes suficientemente largas para provocar en las células un efecto antisentido. También es posible el uso de secuencias de ADN que presentan un alto grado de homología con las secuencias codificantes de un producto génico, pero que no son completamente idénticas.

Con la expresión de moléculas de ácido nucleico en plantas puede localizarse la proteína sintetizada en cualquiera de los compartimentos de la célula vegetal. En cambio, para conseguir la localización en un compartimento determinado, pueden unirse por ejemplo la región codificante con secuencias de ADN, que garantizan la localización en un compartimento determinado. El experto conoce secuencias de este tipo (véase por ejemplo Braun y col., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter y col., Proc. Natl. Acad. Sei. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald y col., Plant J. 1 (1991), 95-106). La expresión de las moléculas de ácido nucleico puede tener lugar también en los orgánulos de las células vegetales.

Las células de plantas transgénicas pueden regenerarse de acuerdo con técnicas conocidas para dar plantas completas. En el caso de las plantas transgénicas puede tratarse principalmente de plantas de cualquier especie vegetal, es decir, plantas tanto monocotiledóneas como dicotiledóneas.

Así pueden obtenerse plantas transgénicas que presentan propiedades modificadas mediante sobreexpresión, subexpresión o inhibición de genes o secuencias génicas homólogos (= naturales) o expresión de genes o secuencias génicas heterólogos (= extraños).

5 Preferentemente los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse en cultivos transgénicos que son resistentes contra fitohormonas, tales como por ejemplo Dicamba o contra herbicidas, que inhiben las enzimas vegetales esenciales, por ejemplo acetolactatosintasas (ALS), EPSP sintasas, glutaminsintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD), respectivamente contra herbicidas del grupo de las sulfonilureas, de los glifosatos, glufosinatos o denzolisoxazoles y principios activos análogos.

10 Con la aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos, además de los efectos observados en otros cultivos frente a plantas nocivas, aparecen con frecuencia efectos que son específicos para la aplicación en el cultivo transgénico respectivo, por ejemplo un espectro de malas hierbas modificado o especialmente ampliado, que puede combatirse, cantidades de aplicación modificadas que pueden usarse para la aplicación, preferentemente buena capacidad de combinación con los herbicidas frente a los que el cultivo transgénico es resistente, así como influir en el crecimiento y el rendimiento de cosecha de las plantas de cultivo transgénicas.

15 Por este motivo es también objetivo de la invención el uso de los compuestos de acuerdo con la invención como herbicidas para combatir plantas nocivas plantas de cultivo transgénicas.

20 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden aplicarse en forma de polvos para espolvorear, concentrados emulsionables, soluciones pulverizables, polvos finos o granulados en las preparaciones habituales. Por lo tanto son objeto de la invención también agentes herbicidas y reguladores del crecimiento de plantas, que contienen los compuestos de acuerdo con la invención.

25 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden formularse de distinta manera, según qué parámetros biológicos y/o físico-químicos están predeterminados. Como posibilidades de formulación se tienen en cuenta por ejemplo: polvos para espolvorear (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones de aceite en agua y de agua en aceite, soluciones pulverizables, concentrados en suspensión (SC), dispersiones a base de aceite o de agua, soluciones miscibles en aceite, suspensiones capsulares (CS), polvos finos (DP), desinfectantes, granulados para aplicación por espolvoreado y en la tierra, granulados (GR) en forma de granulados de adsorción y de elevación, microgranulados, granulados para espolvorear, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV, microcápsulas y ceras. Estos tipos de formulación individuales se conocen en principio y se describen por ejemplo en: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volumen 7, C. Hanser Verlag München, 4ª ed. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

35 Los agentes auxiliares de formulación necesarios tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos se conocen así mismo y se describen por ejemplo en: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2ª ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Enciclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthilenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volumen 7, C. Hanser Verlag München, 4ª ed. 1986.

40 Basándose en estas formulaciones pueden producirse también combinaciones con otras sustancias de efecto pesticida, tales como por ejemplo insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con protectores selectivos, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en forma de una formulación acabada o como mezcla de tanque. Protectores selectivos adecuados son por ejemplo mefenpir-dietilo, cipsosulfamida, osoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo y diclormida.

45 Los polvos para espolvorear son preparaciones dispersables de manera uniforme en agua, que junto al principio activo además de una sustancia inerte o diluyente contienen también tensioactivos de tipo iónico y/o no iónico (agentes humectantes, agentes de dispersión), por ejemplo alquilfenoles polioxietilados, alcoholes grasos polioxietilados, aminas grasas polioxietiladas, poliglicoletersulfatos de alcohol graso, alcanosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, ligninosulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio, dibutilnaftaleno-sulfonato de sodio o también oleoilmetilaurinato de sodio. Para la producción de los polvos para espolvorear se pulverizan los principios activos herbicidas por ejemplo en aparatos habituales tales como molinos de martillo, molinos soplantes y molinos de chorro de aire y al mismo tiempo o a continuación se mezclan con los agentes auxiliares de formulación.

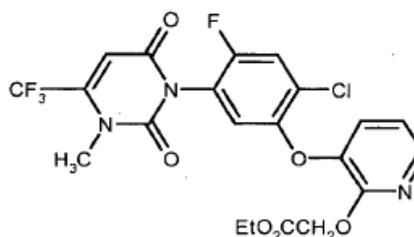
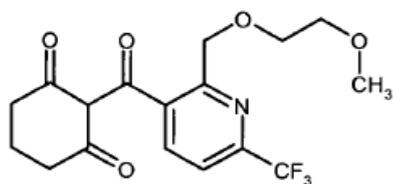
50 Concentrados emulsionables se producen mediante disolución del principio activo en un disolvente orgánico por ejemplo butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también hidrocarburos o compuestos aromáticos de alto punto de ebullición o mezclas de los disolventes orgánicos con la adición de uno o varios tensioactivos de tipo iónico y/o no iónico (emulsionantes). Como emulsionantes pueden usarse por ejemplo: sales de calcio del ácido

- alquilarilsulfónico tales como dodecilsulfonato de Ca o emulsionantes no iónicos tales como poliglicoléteres de ácidos grasos, alquilarilpoliglicol éteres, poliglicoléteres de alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, alquiliéteres, ésteres de sorbitano tales como por ejemplo ésteres de ácidos grasos de sorbitano o ésteres de polioxetilén sorbitano tales como por ejemplo ésteres de ácidos grasos de polioxetilén sorbitano.
- 5 Se obtienen polvos finos mediante molienda del principio activo con sustancias sólidas finamente divididas, por ejemplo talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierras de diatomeas.
- Los concentrados en suspensión pueden ser a base de agua o de aceite. Pueden producirse por ejemplo mediante molienda en húmedo por medio de molinos de perlas comercialmente disponibles y opcionalmente la adición de
- 10 tensioactivos, tal como se ha mencionado ya por ejemplo anteriormente en los otros tipos de formulación.
- Las emulsiones, por ejemplo emulsiones de aceite en agua (EW), pueden producirse por ejemplo por medio de agitadores, molinos coloidales y/o mezcladoras estáticas con el uso de disolventes orgánicos acuosos y opcionalmente tensioactivos, tal como ya se ha mencionado por ejemplo anteriormente en los otros tipos de formulación.
- 15 Los granulados pueden producirse o bien mediante pulverización a chorro del principio activo sobre material inerte granulado, adsorbente, o mediante la aplicación de concentrados de principio activo por medio de aglutinantes, por ejemplo poli(alcohol vinílico), poliacrilato de sodio o también aceites minerales, sobre la superficie de materiales portadores tales como arena, caolinita o de material inerte granulado. Así mismo pueden granularse principios
- 20 activos adecuados de manera habitual para la producción de granulados de fertilizantes, si se desea en mezcla con fertilizantes.
- Los granulados dispersables en agua se producen por regla general de acuerdo con los procedimientos habituales tales como secado por pulverización, granulación en lecho fluidizado, granulación en plato, mezcla con mezcladoras de alta velocidad y extrusión sin material inerte sólido.
- Para la producción de granulados en plato, lecho fluido, de extrusión y de pulverización véanse por ejemplo los
- 25 procedimientos en "Spray-Drying Handbook" 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª ed., McGraw-Hill, Nueva York 1973, páginas 8-57.
- Para más detalles para la formulación de agentes fitoprotectores véase por ejemplo G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, páginas 81-96 y J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.
- 30 Las preparaciones agroquímicas contienen por regla general del 0,1 al 99 % en peso, especialmente del 0,1 al 95 % en peso, de compuestos de acuerdo con la invención.
- En los polvos para espolvorear la concentración de principio activo asciende por ejemplo aproximadamente a del 10 al 90 % en peso, el resto hasta el 100 % en peso consiste en componentes de formulación habituales. En el caso de
- 35 concentrados emulsionables la concentración de principio activo puede ascender a aproximadamente del 1 al 90, preferentemente del 5 al 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvo contienen del 1 al 30 % en peso de principio activo, preferentemente al menos del 5 al 20 % en peso de principio activo, las soluciones pulverizables contienen aproximadamente del 0,05 al 80, preferentemente del 2 al 50 % en peso de principio activo. En el caso de
- 40 granulados dispersables en agua el contenido en principio activo depende en parte de si el compuesto activo se encuentra líquido o sólido y de qué agentes auxiliares de granulación, materiales de relleno etc. se usen. En el caso de los granulados dispersables en agua, el contenido en principio activo se encuentra por ejemplo entre el 1 y el 95 % en peso, preferentemente entre el 10 y el 80 % en peso.
- Además, las formulaciones de principio activo mencionadas contienen opcionalmente los agentes adherentes, humectantes, de dispersión, emulsionantes, de penetración, conservantes, agentes de protección anticongelante y
- 45 disolventes, materiales de carga, soportes y colorantes, agentes antiespumantes, inhibidores de evaporación y agentes que influyen en el valor de pH y en la viscosidad habituales en cada caso.
- Basándose en estas formulaciones pueden producirse también combinaciones con otras sustancias de acción pesticida, tales como por ejemplo insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con protectores selectivos, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en forma de una formulación acabada o como
- 50 mezcla de tanque.
- Como componentes de combinación para los compuestos de acuerdo con la invención en formulaciones de mezcla o en la mezcla de tanque pueden usarse por ejemplo principios activos conocidos, que se basan en una inhibición de por ejemplo acetolactato-sintasa, acetilCoA-carboxilasa, celulosa-sintasa, enolpiruvilshikimat-3-fosfato-sintasa, glutamina-sintetasa, p-hidroxifenilpiruvato-dioxigenasa, fitoendesaturasa, Photosystem I, Photosystem II, protoporfirinógeno-oxidasa, tal como se describen por ejemplo por Weed Research 26 (1986) 441-445 o "The Pesticide Manual", 15ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2009 y la bibliografía citada en el mismo. Como herbicidas o reguladores de crecimiento de plantas conocidos, que pueden
- 55

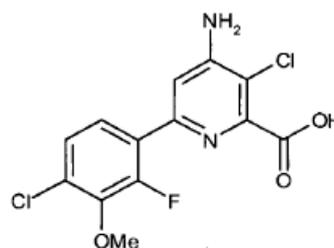
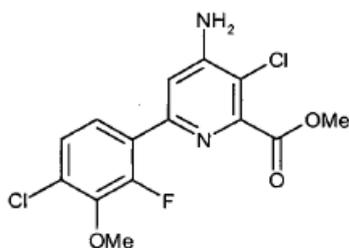
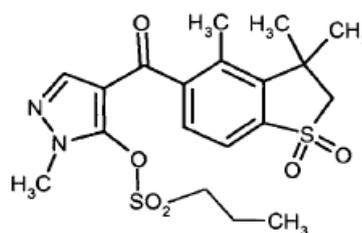
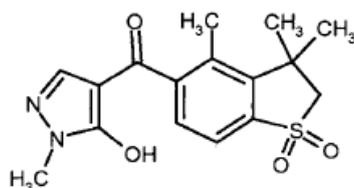
combinarse con los compuestos de acuerdo con la invención, han de mencionarse por ejemplo los siguientes principios activos (los compuestos se designan o bien con el “*common name*” (nombre común) según la *International Organization for Standardization* (ISO) (organización internacional de la normalización) o con los nombres químicos o con el número de código) y comprenden siempre todas las formas de aplicación tales como ácidos, sales, ésteres e isómeros tales como estereoisómeros e isómeros ópticos. A este respecto se mencionan a modo de ejemplo una y en parte también varias formas de aplicación:

5 acetoclor, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, acifluorofén, acifluorofén-sodio, aclonifén, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim-sodio, ametrina, amicarbazona, amidoclor, amidosulfurona, aminociclopraclor, aminopirralida, amitrol, sulfamato de amonio, ancimidol, anilofós, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, aziprotrina, beflubutamida, 10 benazolina, benazolina-etilo, bencarbazona, benfluralina, benfuresato, bensulida, bensulfurona, bensulfurona-metilo, bentazona, benzfendizona, benzobiciclona, benzofenap, benzofluór, benzoilprop, biciclopirona, bifenox, bilanafós, bilanafós-sodio, bispiribac, bispiribac-sodio, bromacilo, bromofenoxima, bromoxinilo, bromurona, buminafós, busoxinona, butaclor, butafenacilo, butamifós, butenaclor, butralina, butroxidima, butilato, cafenestrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etilo, clometoxifeno, cloramben, clorazifop, clorazifop-butilo, 15 clorbromurona, clorbufam, clorfenac, clorfenac-sodio, clorfenprop, clorfurenol, clorfurenol-metilo, cloridazon, clorimuron, clorimuron-etilo, clormequat-cloruro, clornitrofenol, clorofalim, clortal-dimetilo, clorotolurón, clorsulfurona, cinidona, cinidona-etilo, cinmetilina, cinosulfurona, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clofencet, clomazona, clomeprop, cloprop, clopiralida, cloransulam, cloransulam-metilo, cumilurón, cianamida, cianazina, ciclanilida, cicloato, ciclo sulfamurona, ciclo xidima, ciclurón, cihalofop, cihalofop-butilo, ciperquat, ciperazina, ciprazol, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron/dimron, dalapon, daminozida, dazomet, n-decanol, desmedifam, desmetrina, detosil-pirazolato (DTP), 20 dialato, dicamba, diclobenilo, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulam, dietatil, dietatil-etilo, difenoxuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, dimefuron, dicegulac-sodio, dimefuron, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamida, dimetaenamida-P, dimetipina, dimetrasulfurona, dinitramina, dinoseb, dinoterb, difenamida, dipropetrina, diquat, diquat-dibromuro, ditiopir, diuron, DNOC, eglinazina-etilo, endotal, EPTC, esprocarb, etalfuralina, etametsulfurona, etametsulfurona-metilo, etefón, etidimuron, etiozina, etofumesato, etoxifeno, etoxifeno-etilo, etoxisulfurona, etobenzanida, F-5331, es decir N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]-fenil]-etanosulfonamida, F-7967, es decir, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1 H-bencimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2,4(1H, 3H)-diona, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fenoxasulfona, fentrazamida, fenuron, flamprop, 30 flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurona, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, fluazolato, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucetosulfurona, fluclopiralina, flufenacet (tiafluamida), flufenpir, flufenpir-etilo, flumetralina, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, flumipropina, fluometuron, fluorodifen, fluoroglicofen, fluoroglicofen-etilo, flupoxam, flupropacilo, flupropanato, flupirsulfurona, flupirsulfurona-metil-sodio, flurenol, flurenol-butilo, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-metil, flurprimidol, flurtamona, 35 flutiacet, flutiacet-metilo, flutiamida, fomesafen, foramsulfurona, forclorfenuron, fosamina, furiloxifeno, ácido giberélico, glufosinatos, glufosinatos-amonio, glufosinatos-P, glufosinatos-P-amonio, glufosinatos-P-sodio, glifosatos, glifosato-isopropilamonio, H-9201, es decir, O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil)-O-etil-isopropilfosforamidato, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metilo, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HW-02, es decir, 1-(dimetoxifosforil)-etil(2,4-diclorofenoxi)acetato, imazametabenz, 40 imazametabenz-metilo, imazamox, imazamox-amonio, imazapic, imazapir, imazapir-isopropil-amonio, imazaquin, imazaquin-amonio, imazetapir, imazetapir-amonio, imazosulfurona, inabenfida, indanofano, indaziflam, ácido indolacético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico (IBA), yodosulfurona, yodosulfurona-metil-sodio, ioxinilo, ipfencarbazona, isocarbamida, isopropalina, isotroturona, isourona, isoxaben, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, KUH-043, es decir, 3-([5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil]-5,5-dimetil-4,5-dihidro-1,2-oxazol, 45 carbutilato, cetospiradox, lactofeno, lenacilo, linuron, hidrazina de ácido maleico, MCPA, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y -sodio, mecoprop, mecoprop-sodio, mecoprop-butotilo, mecoprop-P-butotilo, mecoprop-P-dimetilamonio, mecoprop-P-2-etilhexilo, mecoprop-P-potasio, mfenacet, mefluidida, mepiquat-cloruro, mesosulfurona, mesosulfurona-metilo, mesotriona, metabenztiurona, metam, metamifop, metamitron, metazaclor, metazosulfurona, metazol, metiozolina, metoxifenona, metildimron, 1-metilciclopropeno, metilisotiocianato, 50 metobenzurona, metobromurona, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxurona, metribuzina, metsulfurona, metsulfurona-metilo, molinato, monalida, monocarbamida, monocarbamida-dihidrogenosulfato, monolinuron, monosulfurona, monosulfurona-éster, monuron, MT 128, es decir, 6-cloro-N-[(2E)-3-cloroprop-2-en-1-il]-5-metil-N-fenilpiridazin-3-amina, MT-5950, es decir N-[3-cloro-4-(1-metiletil)-fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, naproanilida, napropamida, naptalam, NC-310, es decir 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benciloxipirazol, neburon, nicosulfurona, nipraclofen, nitalina, nitrofenol, nitrofenolato-sodio (mezcla isomérica), nitrofluorofeno, ácido nonanoico, norflurazona, orbencarb, ortosulfamuron, orizalina, oxadiargilo, oxadiazona, oxasulfurona, oxaziolomefona, oxifluorofeno, paclobutrazol, paraquat, paraquat-dicloruro, ácido pelargónico (ácido nonanoico), pendimetilina, pendralina, penoxsulam, pentanoclor, pentoxazona, perfluidona, petoxamida, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etilo, picloram, picolinafeno, pinoxaden, piperofós, pirifenop, pirifenop-butilo, pretilaclor, primisulfurona, 60 primisulfurona-metilo, probenazol, profluzol, prociazina, prodiamina, prifluralina, profoxidim, prohexadiona, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, prometon, prometrina, propaclor, propanilo, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, proporisulfurona, propizamida, propulfalina, prosulfofcarb, prosulfuron, prinaclor, piraclonilo, piraflufen, piraflufen-etilo, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfurona, pirazosulfurona-etilo, pirazoxifeno, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, 65 piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, pirifalida, piriminobac, piriminobac-metilo, pirimisulfan, piritiobac,

piritiobac-sodio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, rimsulfurona, saflufenacilo, sebumeton, setoxidima, siduron, simazina, simetrina, SN-106279, es decir, (2R)-2-({7-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-naftil}oxi)propanoato de metilo, sulcotriona, sulfato (CDEC), sulfentazona, sulfometuron, sulfometuron-metilo, sulfosato (glifosato-trimesio), sulfosulfurona, SYN-523, SYP-249, es decir, 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-il-5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato, SYP-300, es decir, 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioximidazolidin-4,5-diona, tebutam, tebutiurona, tecnazeno, tefuriltriona, tembotriona, tepaloxidim, terbacilo, terbucarb, terbuclor, terbumeton, terbutilazina, terbutrina, tenilclor, tiafluamida, tiazaflurona, tiazopir, tidiazimina, tidiazurona, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tifensulfurona, tifensulfurona-metilo, tiobencarb, tiocarbazilo, topramezona, tralcoxidim, triafamona, trialato, triasulfurona, triaziflam, triazofenamida, tribenurona, tribenurona-metilo, ácido tricloroacético (TCA), triclopir, tridifano, trietazina, trifloxisulfurona, trifloxisulfurona-sodio, trifluralina, triflusulfurona, triflusulfurona-metilo, trimeturona, trinexapac, trinexapac-etilo, tritosulfurona, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P, Vernolate, ZJ-0862, es decir, 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]bencil}anilina, así como los siguientes compuestos:



15



Para la aplicación se diluyen las formulaciones presentes en la forma comercialmente disponible opcionalmente de manera habitual por ejemplo en el caso de polvos para espolvorear, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables en agua por medio de agua. Preparaciones en forma de polvo, granulados para el terreno o para espolvorear así como soluciones pulverizables ya no se diluyen antes de la aplicación habitualmente con otras sustancias inertes. Con las condiciones externas tales como temperatura, humedad, el tipo de herbicida usado, entre otras, varía la cantidad de aplicación necesaria de los compuestos de fórmula (I). Puede oscilar dentro de amplios límites, por ejemplo entre 0,001 y 1,0 kg/ha o más de sustancia activa, preferentemente se encuentra sin embargo entre 0,005 y 750 g/ha.

25

Los siguientes ejemplos explican la invención.

A. Ejemplos químicos

1. Síntesis de 2-cloro-4-(metilsulfonil)-N-(1-(2-metoxietil)-tetrazol-5-il)-benzamida, (Ejemplo de tabla N° 1-12)

Se agitan 176 mg (0,75 mmol) de cloruro de 2-cloro-4-(metilsulfonil)-benzoílo, 145 mg (1,0 mmol) de 5-amino-1-(2-metoxietil)-tetrazol en 2 ml de piridina durante 12 h a 60°C. A continuación se añaden 0,1 ml de agua, se agita durante 30 min a 60°C y se mezcla con EE y HCl 2 N. La fase orgánica separada se lava de nuevo con HCl 2 N y solución salina, se seca sobre Na₂SO₄, se evapora y se purifica por medio de RP-HPLC (acetonitrilo/agua).

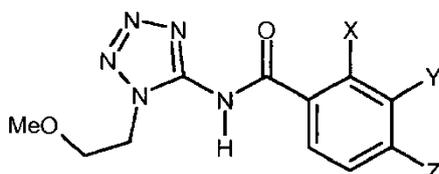
30

Rendimiento 66 mg (23 %).

Síntesis de 5-amino-1-(2-metoxietil)-tetrazol

5 Una mezcla de 2,33 g (10 mmol) de yodhidrato de S-metil-isotiosemicarbazida y 751 mg (10 mmol) de 2-metoxietilamina se calienta en 10 ml de etanol bajo reflujo, hasta que ya no se libera nada de metilmercaptano. A continuación se concentra en gran parte, se mezcla sucesivamente con agitación con 10 ml de agua, 0,3 ml de ácido nítrico concentrado y 1,7 g (10 mmol) de nitrato de plata en 2 ml de agua. Después de 10 min de agitación se mezcla con 0,5 de ácido clorhídrico concentrado, se aspira el precipitado, se lava con 3 ml de agua y se mezcla el filtrado con 1,5 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla se mezcla a < 5°C con 0,7 g (10 mmol) de nitrito de sodio en 2 ml de agua y a continuación se ajusta a pH 10 con hidróxido de sodio al 20 %. A continuación se calienta durante 10 30 min hasta 60 °C y después del enfriamiento se extrae con éster acético. La fase orgánica se lava 3x con solución salina saturada, se seca, se concentra y se recoge el residuo con un poco de éster acético y se filtra. Cristales de color beige, rendimiento 590 mg (40 %). RMN (DMSO-d₆): 6,62 (s.a., 2H), 4,26 (t, 2H), 3,65 (t, 2H), 3,23 (s, 3H).

Tabla 1: Compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I), en la que A representa CY, B representa N y R representa 2-metoxietilo



Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-1	F	H	Cl	
1-2	F	H	Br	
1-3	F	H	SO ₂ Me	
1-4	F	H	SO ₂ Et	
1-5	F	H	CF ₃	
1-6	Cl	H	F	
1-7	Cl	H	Cl	8,13 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,61 (dd, 1H), 4,55 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,22 (s, 3H)
1-8	Cl	H	Br	9,90 (s.a., 1H), 7,69-7,65 (m, 2H), 7,49 (dd, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 3H)
1-9	Cl	H	I	9,67 (s.a., 1H), 7,85 (s, 1H), 7,77 (dd, 1H), 7,51 (d, 1H), 4,60 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,36 (s, 3H)
1-10	Cl	H	SMe	
1-11	Cl	H	SOMe	
1-12	Cl	H	SO ₂ Me	8,04 (d, 1H), 7,98 (dd, 1H), 7,83 (s, 1H), 4,56 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,22 (s, 3H)
1-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl	
1-14	Cl	H	SEt	
1-15	Cl	H	SO ₂ Et	
1-16	Cl	H	CF ₃	9,84 (s.a., 1H), 7,90 (d, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,37 (s, 3H)
1-17	Cl	H	CN	
1-18	Cl	H	NMe ₂	
1-19	Cl	H	NHAc	
1-20	Cl	H	pirrol-1-ilo	
1-21	Cl	H	pirrolidin-1-ilo	
1-22	Cl	H	pirazol-1-ilo	
1-23	Cl	H	1,2,4-triazol-1-ilo	9,62 (s.a., 1H), 8,66 (s, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,76 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,39 (s, 3H)

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-24	Cl	H	4-metil-3-trifluorometil-1,2,4-triazolin-5-on-1-ilo	
1-25	Br	H	F	
1-26	Br	H	Cl	9,79 (s.a., 1H), 7,68-7,64 (m, 2H), 7,45 (dd, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 3H)
1-27	Br	H	Br	
1-28	Br	H	SMe	9,8 (s.a., 1H), 7,65 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,26 (dd, 1H), 4,65 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,52 (s, 3H)
1-29	Br	H	SO ₂ Me	
1-30	Br	H	SO ₂ Et	
1-31	Br	H	CF ₃	
1-32	OMe	H	SO ₂ Me	
1-33	SMe	H	F	
1-34	SMe	H	Cl	10,65 (s.a., 1H), 7,83 (d, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,28 (dd, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 2,49 (s, 3H)
1-35	SO ₂ Me	H	Cl	
1-36	SMe	H	Br	
1-37	SO ₂ Me	H	Br	
1-38	SMe	H	SMe	
1-39	SO ₂ Me	H	SMe	
1-40	SO ₂ Me	H	SOMe	
1-41	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me	
1-42	SMe	H	CF ₃	10,6 (s.a., 1H), 7,95 (d, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, 1H), 4,67 (t, 2H), 3,85 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 2,53 (s, 3H)
1-43	SOMe	H	CF ₃	
1-44	SO ₂ Me	H	CF ₃	8,18 (s, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 4,42 (m, 2H), 3,71 (m, 2H), 3,54 (s, 3H), 3,21 (s, 3H)
1-45	SO ₂ Et	H	Cl	
1-46	SO ₂ Et	H	Br	
1-47	SO ₂ Et	H	SMe	
1-48	SO ₂ Et	H	SOMe	
1-49	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me	
1-50	SO ₂ Et	H	CF ₃	
1-51	SO ₂ NMe Ph	H	Cl	
1-52	SO ₂ NMe 2	H	CF ₃	
1-53	NO ₂	H	F	
1-54	NO ₂	H	Cl	
1-55	NO ₂	H	Br	
1-56	NO ₂	H	I	
1-57	NO ₂	H	CN	
1-58	NO ₂	H	SO ₂ Me	
1-59	NO ₂	H	SO ₂ Et	
1-60	NO ₂	H	CF ₃	10,3 (s.a., 1H), 8,44 (s, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,86 (t, 2H), 3,44 (s, 3H)
1-61	Me	H	F	
1-62	Me	H	OCF ₃	
1-63	Me	H	Cl	
1-64	Me	H	Br	
1-65	Me	H	SO ₂ Me	
1-66	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl	
1-67	Me	H	SO ₂ Et	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-68	Me	H	CF ₃	
1-69	CH ₂ SMe	H	Br	10,05 (s.a., 1H), 7,58-7,52 (m, 3H), 4,65 (t, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 2,05 (s, 3H)
1-70	CH ₂ SO ₂ Me	H	Br	9,80 (s.a., 1H), 7,72-7,68 (m, 2H), 7,59 (d, 1H), 4,74 (s, 2H), 4,62 (t, 2H), 3,81 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,98 (s, 3H)
1-71	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	
1-72	Et	H	F	
1-73	Et	H	Cl	
1-74	Et	H	Br	
1-75	Et	H	SO ₂ Me	
1-76	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl	
1-77	Et	H	SEt	
1-78	Et	H	SO ₂ Et	
1-79	Et	H	CF ₃	
1-80	CF ₃	H	Cl	10,05 (s.a., 1H), 7,76 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 4,61 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,33 (s, 3H)
1-81	CF ₃	H	Br	
1-82	CF ₃	H	SO ₂ Me	
1-83	CF ₃	H	SO ₂ NMe ₂	10,5 (s.a., 1H), 8,14 (s, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,81 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 2,80 (s, 6H)
1-84	CF ₃	H	CF ₃	
1-85	NO ₂	NH ₂	F	
1-86	NO ₂	NHMe	F	
1-87	NO ₂	NMe ₂	F	
1-88	NO ₂	Me	Cl	
1-89	NO ₂	NH ₂	Cl	
1-90	NO ₂	NHMe	Cl	
1-91	NO ₂	NMe ₂	Cl	
1-92	NO ₂	NH ₂	Br	
1-93	NO ₂	NHMe	Br	
1-94	NO ₂	NMe ₂	Br	
1-95	NO ₂	NH ₂	CF ₃	
1-96	NO ₂	NMe ₂	CF ₃	
1-97	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me	
1-98	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et	
1-99	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me	
1-100	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me	
1-101	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et	
1-102	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-103	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-104	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-105	Me	SMe	H	
1-106	Me	SOMe	H	
1-107	Me	SO ₂ Me	H	
1-108	Me	SEt	H	
1-109	Me	SOEt	H	
1-110	Me	SO ₂ Et	H	
1-111	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H	
1-112	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H	
1-113	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H	
1-114	Me	F	F	
1-115	Me	SEt	F	
1-116	Me	SOEt	F	
1-117	Me	SO ₂ Et	F	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-118	Me	Me	Cl	9,75 (s.a., 1H), 7,35 (d, 1H), 7,34 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,40 (s, 3H)
1-119	Me	NH ₂	Cl	
1-120	Me	NHMe	Cl	
1-121	Me	NMe ₂	Cl	
1-122	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-123	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	9,84 (s.a., 1H), 7,35 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,00 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,64 (t, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,35 (s, 3H), 2,49 (s, 3H), 2,11 (m, 2H)
1-124	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl	
1-125	Me	O(CH ₂) ₂ SMe	Cl	11,45 (s.a., 1H), 7,51 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 4,54 (t, 2H), 4,07 (t, 2H), 3,75 (t, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,92 (t, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,16 (s, 3H)
1-126	Me	O(CH ₂) ₂ SEt	Cl	
1-127	Me	O(CH ₂) ₃ SMe	Cl	
1-128	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	10,27 (s.a., 1H), 7,39 (d,H), 7,32 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 4,60 (s, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,06 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,41 (s, 3H)
1-129	Me	O(CH ₂) ₂ CONMe ₂	Cl	
1-130	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl	
1-131	Me	O(CH ₂) ₂ NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl	
1-132	Me	O(CH ₂) ₂ NHCO ₂ Me	Cl	
1-133	Me	OCH ₂ NHSO ₂ cPr	Cl	
1-134	Me	O(CH ₂)-5-(2,4-dimetil- 2,4-dihidro)-3H-1,2,4- triazol-3-ona	Cl	
1-135	Me	O(CH ₂)-3,5-dimetil-1,2- oxazol-4-ilo	Cl	
1-136	Me	F	Cl	
1-137	Me	Cl	Cl	
1-138	Me	SMe	Cl	
1-139	Me	SOMe	Cl	
1-140	Me	SO ₂ Me	Cl	
1-141	Me	SEt	Cl	
1-142	Me	SOEt	Cl	
1-143	Me	SO ₂ Et	Cl	
1-144	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-145	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-146	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-147	Me	NH ₂	Br	
1-148	Me	NHMe	Br	
1-149	Me	NMe ₂	Br	
1-150	Me	OMe	Br	9,94 (s.a., 1H), 7,53 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,83 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,22 (s, 3H), 2,51 (s, 3H)
1-151	Me	OEt	Br	
1-152	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	9,86 (s.a., 1H), 7,52 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,10 (t, 2H), 3,84-3,78 (m, 4H), 3,47 (s, 3H), 3,36 (s, 3H), 2,53 (s, 3H)
1-153	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Br	9,81 (s.a., 1H), 7,52 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 4,61 (t, 2H), 4,01 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,65 (t, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,35 (s, 3H), 2,50 (s, 3H), 2,13 (m, 2H)

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-154	Me	O(CH ₂) ₂ SMe	Br	11,46 (s.a., 1 H), 7,65 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,54 (t, 2H), 4,05 (t, 2H), 3,75 (t, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,93 (t, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,17 (s, 3H)
1-155	Me	O(CH ₂) ₂ SEt	Br	11,45 (s.a., 1H), 7,65 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,54 (t, 2H), 4,03 (t, 2H), 3,75 (t, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,96 (t, 2H), 2,63 (q, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,22 (t, 3H)
1-156	Me	O(CH ₂) ₃ SMe	Br	
1-157	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Br	10,32 (s.a., 1H), 7,49 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,57 (s, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,05 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,38 (s, 3H)
1-158	Me	O(CH ₂)-5-pirrolidin-2-ona	Br	
1-159	Me	SMe	Br	
1-160	Me	SOMe	Br	
1-161	Me	SO ₂ Me	Br	
1-162	Me	SEt	Br	9,22 (s.a., 1H), 7,64 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 4,60 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,88 (q, 2H), 2,79 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)
1-163	Me	SOEt	Br	9,60 (s.a., 1H), 7,56 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 4,60 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,29-3,34 (m, 1H), 3,10-3,15 (m, 1H), 2,82 (s, 3H), 1,42 (t, 3H)
1-164	Me	SO ₂ Et	Br	9,38 (s.a., 1H), 7,78 (d, 1H), 7,46 (s.a., 1H), 4,60 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,50 (q, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 1,39 (t, 3H)
1-165	Me	SMe	I	
1-166	Me	SOMe	I	
1-167	Me	SO ₂ Me	I	
1-168	Me	SEt	I	
1-169	Me	SOEt	I	
1-170	Me	SO ₂ Et	I	
1-171	Me	Cl	CF ₃	9,95 (s.a., 1H), 7,68 (d,H), 7,56 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,59 (s, 3H)
1-172	Me	SMe	CF ₃	7,74 (d,H), 7,68 (d, 1H), 4,48 (m, 2H), 3,74 (m, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,70 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)
1-173	Me	SOMe	CF ₃	7,90 (s, 2H), 4,59 (t, 2H), 3,76 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 3,06 (s, 3H), 2,88 (s, 3H)
1-174	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,89 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 4,37 (m, 2H), 3,71 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,22 (s, 3H), 2,75 (s, 3H)
1-175	Me	SEt	CF ₃	
1-176	Me	SOEt	CF ₃	
1-177	Me	SO ₂ Et	CF ₃	
1-178	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-179	Me	S(O)(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-180	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-181	Me	SMe	OMe	
1-182	Me	SOMe	OMe	
1-183	Me	SO ₂ Me	OMe	
1-184	Me	SEt	OMe	
1-185	Me	SOEt	OMe	
1-186	Me	SO ₂ Et	OMe	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-187	Me	Me	SMe	9,75 (s.a., 1H), 7,45 (d, 1H), 7,08 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,35 (s, 1H), 2,50 (s, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,32 (s, 3H)
1-188	Me	Me	SO ₂ Me	9,90 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,51 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,35 (s, 1H), 3,13 (s, 3H), 2,70 (s, 3H), 2,48 (s, 3H)
1-189	Me	Me	SEt	
1-190	Me	Me	SO ₂ Et	
1-191	Me	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Me	
1-192	Me	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Et	
1-193	Me	5-cianometil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Me	
1-194	Me	5-cianometil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Et	
1-195	Me	NH ₂	SO ₂ Me	
1-196	Me	NHMe	SO ₂ Me	
1-197	Me	NMe ₂	SO ₂ Me	9,95 (s.a., 1H), 7,99 (d, 1H), 7,51 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,37 (s, 1H), 3,27 (s, 3H), 2,92 (s, 6H), 2,50 (s, 3H)
1-198	Me	NHEt	SO ₂ Me	
1-199	Me	NHnPr	SO ₂ Me	
1-200	Me	NHiPr	SO ₂ Me	9,87 (s.a., 1H), 7,80 (d, 1H), 7,12 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,77 (sept, 1H), 3,36 (s, 1H), 3,11 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,22 (d, 6H)
1-201	Me	NHcPr	SO ₂ Me	9,71 (s.a., 1H), 7,75 (d, 1H), 7,06 (d, 1H), 6,25 (s.a., 1H), 4,64 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 1H), 3,00 (s, 3H), 2,84 (m, 1H), 2,60 (s, 3H), 0,81 (m, 2H), 0,61 (m, 2H)
1-202	Me	NHiBu	SO ₂ Me	
1-203	Me	NHCH ₂ cPr	SO ₂ Me	
1-204	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	9,95 (s.a., 1H), 7,81 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,60 (t, 2H), 3,42 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,36 (s, 3H), 3,20 (s, 3H), 2,43 (s, 3H)
1-205	Me	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-206	Me	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-207	Me	NHCH ₂ CH(OMe)Me	SO ₂ Me	
1-208	Me	NHCH ₂ CH(OMe)CH ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-209	Me	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me	
1-210	Me	NHCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Me	9,91 (s.a., 1H), 7,81 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 4,15 (m, 1H), 3,91 (dd, 1H), 3,84 (t, 2H), 3,79 (dd, 1H), 3,43 (dd, 1H), 3,36 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), 3,18 (dd, 1H), 2,43 (s, 3H), 2,09-1,90 (m, 3H), 1,72-1,63 (m, 1H)
1-211	Me	NHCH ₂ -(4-Me-[1,3]dioxolan-2-ilo)	SO ₂ Me	
1-212	Me	NH(CH ₂) ₂ -(4-Me-[1,3]dioxolan-2-ilo)	SO ₂ Me	
1-213	Me	NHCH ₂ -[1,3]dioxan-2-ilo	SO ₂ Me	
1-214	Me	NHCH ₂ CONHEt	SO ₂ Me	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-215	Me	pirazol-1-ilo	SO ₂ Me	11,80 (s.a., 1H), 8,11 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 6,59 (t, 1H), 4,58 (t, 2H), 3,77 (t, 2H), 3,22 (s, 3H), 3,05 (s, 3H), 1,90 (s, 3H)
1-216	Me	3,5-Me ₂ -pirazol-1-ilo	SO ₂ Me	
1-217	Me	1,2,3-triazol-1-ilo	SO ₂ Me	
1-218	Me	1,2,4-triazol-1-ilo	SO ₂ Me	
1-219	Me	OH	SO ₂ Me	
1-220	Me	OMe	SO ₂ Me	10,2 (s.a., 1H), 7,91 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 4,65 (t, 2H), 3,98 (s, 1H), 3,84 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,26 (s, 3H), 2,53 (s, 3H)
1-221	Me	OMe	SO ₂ Et	
1-222	Me	OEt	SO ₂ Me	
1-223	Me	OEt	SO ₂ Et	
1-224	Me	OiPr	SO ₂ Me	
1-225	Me	OiPr	SO ₂ Et	
1-226	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-227	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-228	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-229	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-230	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-231	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-232	Me	O(CH ₂) ₂ SMe	SO ₂ Me	
1-233	Me	O(CH ₂) ₂ SEt	SO ₂ Me	
1-234	Me	O(CH ₂) ₃ SMe	SO ₂ Me	
1-235	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-236	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et	
1-237	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me	10,5 (s.a., 1H), 7,94 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 4,82 (s, 2H), 4,67 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,36 (s, 3H), 3,04 (s, 3H), 2,95 (s, 3H), 2,53 (s, 3H)
1-238	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et	
1-239	Me	OCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Me	
1-240	Me	OCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Et	
1-241	Me	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Me	
1-242	Me	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Et	
1-243	Me	F	SMe	
1-244	Me	F	SO ₂ Me	
1-245	Me	Cl	SO ₂ Me	10,05 (s.a., 1H), 8,11 (d,H), 7,61 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 2,61 (s, 3H)
1-246	Me	SMe	SO ₂ Me	7,99 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 4,49 (t, 2H), 3,74 (t, 2H), 3,52 (s, 3H), 3,23 (s, 3H), 2,69 (s, 3H), 2,38 (s, 3H)
1-247	Me	SOMe	SO ₂ Me	
1-248	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	11,80 (s.a., 1H), 8,28 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 4,59 (t, 2H), 3,77 (t, 2H), 3,60 (s, 1H), 3,58 (s, 3H), 3,23 (s, 3H), 2,72 (s, 3H)
1-249	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et	
1-250	Me	SEt	SO ₂ Me	
1-251	Me	SOEt	SO ₂ Me	
1-252	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-253	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-254	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-255	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-256	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me	
1-257	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-258	CH ₂ O(C H ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-259	CH ₂ O(C H ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me	
1-260	CH ₂ O(C H ₂) ₃ O Me	OMe	SO ₂ Me	
1-261	CH ₂ O(C H ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-262	CH ₂ O(C H ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-263	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-264	Et	OMe	SO ₂ Me	
1-265	Et	OMe	SO ₂ Et	
1-266	Et	OEt	SO ₂ Me	
1-267	Et	OEt	SO ₂ Et	
1-268	Et	OiPr	SO ₂ Me	
1-269	Et	OiPr	SO ₂ Et	
1-270	Et	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-271	Et	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-272	Et	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-273	Et	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-274	Et	F	SO ₂ Me	
1-275	Et	SMe	Cl	
1-276	Et	SOMe	Cl	
1-277	Et	SO ₂ Me	Cl	
1-278	Et	SMe	Br	
1-279	Et	SOMe	Br	
1-280	Et	SO ₂ Me	Br	
1-281	Et	SMe	I	
1-282	Et	SOMe	I	
1-283	Et	SO ₂ Me	I	
1-284	Et	SMe	CF ₃	
1-285	Et	SOMe	CF ₃	
1-286	Et	SO ₂ Me	CF ₃	
1-287	Et	SMe	SO ₂ Me	
1-288	Et	SOMe	SO ₂ Me	
1-289	Et	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-290	nPr	SMe	Cl	
1-291	nPr	SOMe	Cl	
1-292	nPr	SO ₂ Me	Cl	
1-293	nPr	SMe	CF ₃	
1-294	nPr	SOMe	CF ₃	
1-295	nPr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-296	iPr	SMe	Cl	
1-297	iPr	SOMe	Cl	
1-298	iPr	SO ₂ Me	Cl	
1-299	iPr	SMe	CF ₃	
1-300	iPr	SOMe	CF ₃	
1-301	iPr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-302	cPr	SMe	CF ₃	
1-303	cPr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-304	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F	
1-305	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F	
1-306	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F	
1-307	CF ₃	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	F	
1-308	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-309	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	
1-310	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	
1-311	CF ₃	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	Cl	
1-312	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-313	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	
1-314	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br	
1-315	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br	
1-316	CF ₃	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	Br	
1-317	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I	
1-318	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I	
1-319	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I	
1-320	CF ₃	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	I	
1-321	CF ₃	F	SO ₂ Me	
1-322	CF ₃	F	SO ₂ Et	
1-323	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-324	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-325	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-326	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-327	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me	
1-328	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et	
1-329	CF ₃	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Me	
1-330	CF ₃	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Et	
1-331	F	SMe	CF ₃	
1-332	F	SOMe	CF ₃	
1-333	F	SO ₂ Me	CF ₃	
1-334	Cl	SMe	H	
1-335	Cl	SOMe	H	
1-336	Cl	SO ₂ Me	H	
1-337	Cl	SEt	H	
1-338	Cl	SOEt	H	
1-339	Cl	SO ₂ Et	H	
1-340	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	H	
1-341	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	H	
1-342	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H	
1-343	Cl	SMe	Me	7,40-7,42 (m, 1H), 7,08-7,10 (m, 1H), 4,30-4,60 (m, 2H), 3,70-3,75 (m, 2H), 3,35-3,50 (m, 2H), 2,54 (s, 3H), 2,29 (s, 3H)
1-344	Cl	SOMe	Me	9,52 (s.a., 1H), 7,62 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 4,60 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,78 (s, 3H)
1-345	Cl	SO ₂ Me	Me	9,45 (s.a., 1H), 7,69 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 4,59 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,29 (s, 3H), 2,83 (s, 3H)
1-346	Cl	SEt	Me	
1-347	Cl	SOEt	Me	
1-348	Cl	SO ₂ Et	Me	
1-349	Cl	Me	Cl	9,71 (s.a., 1H), 7,49 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,53 (s, 3H)
1-350	Cl	CH ₂ -pirrolidin-2-on-1-ilo	Cl	9,8 (s.a., 1H), 7,60 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 4,83 (s, 2H), 4,61 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,38 (s, 1H), 3,13 (m, 2H), 2,39 (m, 2H), 1,96 (m, 2H)
1-351	Cl	CH ₂ (4-Metil-3-isopropoxi-1,2,4-triazolin-5-on-1-ilo)	Cl	
1-352	Cl	CH ₂ (4-Metil-3-trifluoroetoxi-1,2,4-triazolin-5-on-1-ilo)	Cl	
1-353	Cl	NH ₂	Cl	9,55 (s.a., 1H), 7,32 (d, 1H), 7,01 (d, 1H), 4,71 (s, 2H), 4,61 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,35 (s, 3H)
1-354	Cl	NHAc	Cl	
1-355	Cl	NHCON(Me)OMe	Cl	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-356	Cl	NHCH ₂ CONHEt	Cl	
1-357	Cl	NHCH ₂ CONHiPr	Cl	
1-358	Cl	NHCHMeCONHEt	Cl	
1-359	Cl	imidazolidin-2-on-1-ilo	Cl	11,4 (s.a., 1H), 7,49 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 6,02 (s.a., 1H), 4,64 (t, 2H), 3,85-3,68 (m, 6H), 3,33 (s, 3H)
1-360	Cl	1-metil-1,2,4-triazolidin-3,5-dion-4-ilo)	Cl	10,6 (s.a., 1H), 9,8 (s.a., 1H), 7,70 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 4,65 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,33 (s, 3H)
1-361	Cl	OMe	Cl	9,85 (s.a., 1H), 7,48 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 3,94 (s, 3H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 3H)
1-362	Cl	OEt	Cl	9,90 (s.a., 1H), 7,46 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 4,13 (q, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 1,48 (t, 3H)
1-363	Cl	OPr	Cl	
1-364	Cl	O-alilo	Cl	
1-365	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl	
1-366	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	9,32 (s.a., 1H), 7,47 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,59 (t, 2H), 4,21 (t, 2H), 3,81 (q, 2H), 3,46 (s, 3H), 3,36 (s, 3H)
1-367	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	
1-368	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl	9,95 (s.a., 1H), 7,80 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 4,68 (s, 2H), 4,60 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,36 (s, 1H) 3,09 (s, 3H), 3,01 (s, 3H)
1-369	Cl	O(CH ₂)-5-pirrolidin-2-ona	Cl	
1-370	Cl	Cl	Cl	9,95 (s.a., 1H), 7,58 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,37 (s, 1H)
1-371	Cl	SMe	Cl	
1-372	Cl	SOMe	Cl	
1-373	Cl	SO ₂ Me	Cl	
1-374	Cl	SEt	Cl	
1-375	Cl	SOEt	Cl	
1-376	Cl	SO ₂ Et	Cl	
1-377	Cl	Me	Br	
1-378	Cl	CH ₂ (4-Metil-3-isopropoxi-1,2,4-triazolin-5-on-1-ilo)	Br	
1-379	Cl	CH ₂ (4-Metil-3-trifluoroetoxi-1,2,4-triazolin-5-on-1-ilo)	Br	
1-380	Cl	NHAc	Br	
1-381	Cl	NHCON(Me)OMe	Br	
1-382	Cl	NHCH ₂ CONHEt	Br	
1-383	Cl	NHCH ₂ CONHiPr	Br	
1-384	Cl	NHCHMeCONHEt	Br	
1-385	Cl	OMe	Br	9,49 (s.a., 1H), 7,62 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 4,60 (t, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,82 (t, 2H), 3,37 (s, 3H),
1-386	Cl	OEt	Br	
1-387	Cl	OPr	Br	
1-388	Cl	O-alilo	Br	
1-389	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Br	
1-390	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	11,71 (s.a., 1H), 7,81 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 4,56 (t, 2H), 4,24 (t, 2H), 3,77 (t, 2H), 3,74 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,23 (s, 3H)
1-391	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	Br	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-392	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br	
1-393	Cl	O(CH ₂)-5-pirrolidin-2-ona	Br	
1-394	Cl	Cl	Br	
1-395	Cl	SMe	Br	
1-396	Cl	SOMe	Br	
1-397	Cl	SO ₂ Me	Br	
1-398	Cl	SEt	Br	
1-399	Cl	SOEt	Br	
1-400	Cl	SO ₂ Et	Br	
1-401	Cl	Me	SMe	
1-402	Cl	Me	SO ₂ Me	
1-403	Cl	Me	SO ₂ Et	
1-404	Cl	CO ₂ H	SO ₂ Me	
1-405	Cl	COOMe	SO ₂ Me	
1-406	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me	
1-407	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me	
1-408	Cl	CH ₂ N(OMe)Et	SO ₂ Me	
1-409	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-410	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-411	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-412	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et	
1-413	Cl	CH ₂ OiPr	SO ₂ Me	
1-414	Cl	CH ₂ OcPentilo	SO ₂ Me	
1-415	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me	
1-416	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SMe	9,74 (s.a., 1H), 7,70 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,61 (t, 2H), 4,27 (q, 2H), 3,72 (t, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,22 (s, 3H)
1-417	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	7,99 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,37 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 3,81 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,55 (s, 3H)
1-418	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	
1-419	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me	
1-420	Cl	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-421	Cl	CH ₂ PO ₃ Me ₂	SO ₂ Me	
1-422	Cl	CH ₂ O-tetrahidro-furan-3-ilo	SO ₂ Me	
1-423	Cl	CH ₂ O-tetrahidrofuran-3-ilo	SO ₂ Et	
1-424	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Me	9,65 (s.a., 1H), 8,18 (d, 1H), 7,77 (d, 1H), 5,20 (s, 2H), 4,61 (t, 2H), 4,08 (m, 1H), 3,83 (t, 2H), 3,82-3,58 (m, 4H), 3,37 (s, 3H), 3,33 (s, 3H), 2,0-1,8 (m, 3H), 1,63-1,5 (m, 1H),
1-425	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Et	
1-426	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahidrofuran-3-ilo	SO ₂ Me	
1-427	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahidrofuran-3-ilo	SO ₂ Et	
1-428	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SMe	
1-429	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Me	
1-430	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Et	
1-431	Cl	5-cianometil- 4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Me	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-432	Cl	5-cianometil- 4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Et	10,35 (s.a., 1H), 8,14 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 5,16 (m, 1H), 4,65 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,73 (dd, 1H), 3,38 (s, 3H), 3,37 (q, 2H), 3,27 (dd, 1H), 2,95 (dd, 1H), 2,85 (dd, 1H), 1,31 (t, 3H)
1-433	Cl	5-(MeOCH ₂)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Me	
1-434	Cl	5-(MeOCH ₂)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Et	
1-435	Cl	5-Me-5-(MeOCH ₂)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Me	
1-436	Cl	5-Me-5-(MeOCH ₂)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO ₂ Et	
1-437	Cl	NH ₂	SO ₂ Me	
1-438	Cl	NHMe	SO ₂ Me	
1-439	Cl	NMe ₂	SO ₂ Me	
1-440	Cl	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-441	Cl	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-442	Cl	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-443	Cl	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-444	Cl	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-445	Cl	NH(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-446	Cl	NH(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-447	Cl	pirazol-1-ilo	SO ₂ Me	
1-448	Cl	OMe	SO ₂ Me	
1-449	Cl	OMe	SO ₂ Et	
1-450	Cl	OEt	SO ₂ Me	9,41 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,56 (d.a., 1H), 4,61 (t, 2H), 4,32 (q, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,29 (s, 3H), 1,42 (t, 3H)
1-451	Cl	OEt	SO ₂ Et	
1-452	Cl	OPr	SO ₂ Me	9,56 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,55 (d.a., 1H), 4,62 (t, 2H), 4,22 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,28 (s, 3H), 1,95 (quin, 2H), 1,09 (t, 3H)
1-453	Cl	OPr	SO ₂ Et	11,86 (s.a., 1H), 7,93 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 4,58 (t, 2H), 4,15 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,51 (q, 2H), 3,24 (s, 3H), 1,88 (sex, 2H), 1,13 (t, 3H), 1,05 (t, 3H)
1-454	Cl	OiPr	SO ₂ Me	
1-455	Cl	OiPr	SO ₂ Et	
1-456	Cl	O-alilo	SO ₂ Me	9,35 (s.a., 1H), 8,03 (d, 1H), 7,58 (d.a., 1H), 6,19 (m, 1H), 5,51 (dd, 1H), 5,37 (dd, 1H), 4,75 (d, 2H), 4,61 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,28 (s, 3H)
1-457	Cl	O-alilo	SO ₂ Et	
1-458	Cl	O-propargilo	SO ₂ Me	9,63 (s.a., 1H), 8,03 (d, 1H), 7,61 (d.a., 1H), 4,92 (s, 2H), 4,63 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 2,66 (t, 1H)
1-459	Cl	O-propargilo	SO ₂ Et	
1-460	Cl	O(CH ₂) ₂ F	SO ₂ Me	9,50 (s.a., 1H), 8,04 (d, 1H), 7,52 (d.a., 1H), 3,89-3,91 (m, 1H), 4,77-4,79 (m, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,55 (s.a., 1H), 4,48 (s.a., 1H), 3,84 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,31 (s, 3H)
1-461	Cl	O(CH ₂) ₂ F	SO ₂ Et	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-462	Cl	O(CH ₂) ₂ Cl	SO ₂ Me	9,56 (s.a., 1H), 8,04 (d, 1H), 7,52 (d.a., 1H), 4,62 (t, 2H), 4,51 (t, 2H), 3,95 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,41 (s, 3H), 3,32 (s, 3H)
1-463	Cl	O(CH ₂) ₂ Cl	SO ₂ Et	9,61 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,60 (d.a., 1H), 4,62 (t, 2H), 4,50 (t, 2H), 3,94 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,48 (q, 2H), 3,40 (s, 3H), 1,28 (t, 3H)
1-464	Cl	OCH ₂ cPr	SO ₂ Me	9,42 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 4,61 (t, 2H), 4,09 (d, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,33 (s, 3H), 1,40-1,49 (m, 1H), 0,65-0,70 (m, 2H), 0,45-0,50 (m, 2H)
1-465	Cl	OCH ₂ cPr	SO ₂ Et	9,50 (s.a., 1H), 8,00 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,08 (d, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,51 (q, 2H), 3,38 (s, 3H), 1,42-1,46 (m, 1H), 1,27 (t, 3H), 0,65-0,70 (m, 2H), 0,44-0,48 (m, 2H)
1-466	Cl	OCH ₂ cBu	SO ₂ Me	9,41 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,24 (d, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,27 (s, 3H), 2,89-2,98 (m, 1H), 2,13-2,21 (m, 2H), 1,90-2,05 (m, 4H)
1-467	Cl	OCH ₂ cBu	SO ₂ Et	
1-468	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	7,76 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 4,33 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 3,77 (q, 2H), 3,71 (t, 2H), 3,36 (s, 6H), 3,29 (s, 3H)
1-469	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-470	Cl	O(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-471	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-472	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-473	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-474	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-475	Cl	O(CH ₂) ₂ OCF ₃	SO ₂ Me	11,88 (s.a., 1H), 7,97 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 4,57 (q, 2H), 4,54-4,56 (m, 2H), 4,43-4,48 (m, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,24 (s, 3H)
1-476	Cl	O(CH ₂) ₂ OCF ₃	SO ₂ Et	11,88 (s.a., 1H), 7,96 (d, 1H), 7,76 (d, 1H), 4,58 (t, 2H), 4,53-4,56 (m, 2H), 4,43-4,46 (m, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,42 (q, 2H), 3,24 (s, 3H), 1,15 (t, 3H)
1-477	Cl	O(CH ₂) ₂ SMe	SO ₂ Me	
1-478	Cl	O(CH ₂) ₂ SEt	SO ₂ Me	
1-479	Cl	O(CH ₂) ₃ SMe	SO ₂ Me	
1-480	Cl	OCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Me	
1-481	Cl	OCH ₂ -tetrahidrofuran-2-ilo	SO ₂ Et	
1-482	Cl	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Me	
1-483	Cl	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Et	
1-484	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me	10,6 (s.a., 1H), 8,02 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,44 (s, 3H), 3,37 (s, 3H), 3,03 (s, 3H), 2,93 (s, 3H)
1-485	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et	10,7 (s.a., 1H), 8,00 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,65 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,64 (q, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,02 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)
1-486	Cl	F	SMe	

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-487	Cl	Cl	SO ₂ Me	9,9 (s.a., 1H), 8,21 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,33 (s, 3H)
1-488	Cl	SMe	SO ₂ Me	11,9 (s.a., 1H), 8,15 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 4,58 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,59 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), 2,50 (s, 3H)
1-489	Cl	SOMe	SO ₂ Me	11,8 (s.a., 1H), 8,05 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 4,42 (t, 2H), 3,73 (t, 2H), 3,51 (s, 3H), 3,22 (s, 3H), 3,18 (s, 3H)
1-490	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Me	12,0 (s.a., 1H), 8,39 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 4,59 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,58 (s, 3H), 3,24 (s, 3H)
1-491	Br	OMe	Br	9,80 (s.a., 1H), 7,65 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 4,65 (t, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,84 (t, 2H), 3,36 (s, 3H)
1-492	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	
1-493	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	Br	
1-494	Br	OMe	SO ₂ Me	9,60 (s.a., 1H), 7,89 (d, 1H), 7,23 (d, 1H), 4,66 (t, 2H), 4,06 (s, 3H), 3,82 (t, 2H), 3,41 (s, 3H), 3,22 (s, 3H)
1-495	Br	OMe	SO ₂ Et	
1-496	Br	OEt	SO ₂ Me	
1-497	Br	OEt	SO ₂ Et	
1-498	Br	OPr	SO ₂ Me	
1-499	Br	OPr	SO ₂ Et	
1-500	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-501	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-502	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-503	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-504	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-505	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-506	Br	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Me	
1-507	Br	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Et	
1-508	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-509	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-510	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-511	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-512,	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-513	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-514	I	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Me	
1-515	I	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO ₂ Et	
1-516	OH	SO ₂ Me	CF ₃	
1-517	OMe	SMe	CF ₃	7,76 (d,H), 7,68 (d, 1H), 4,53 (t, 2H), 3,96 (s, 3H), 3,77 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 2,44 (s, 3H)
1-518	OMe	SOMe	CF ₃	7,76 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 4,53 (t, 2H), 3,96 (s, 3H), 3,77 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 2,44 (s, 3H)
1-519	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	
1-520	OMe	SEt	CF ₃	
1-521	OMe	SOEt	CF ₃	
1-522	OMe	SO ₂ Et	CF ₃	
1-523	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-524	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-525	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-526	OMe	CH ₂ N(SO ₂ Me)Et	Cl	
1-527	OMe	NHCOMe	Cl	10,26 (s.a., 1H), 7,99 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 4,57 (t, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,80 (t, 2H), 3,30 (s, 3H), 2,30 (s.a., 3H)
1-528	OMe	NHCOEt	Cl	
1-529	OMe	NHCOiPr	Cl	

ES 2 542 681 T3

(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-530	OMe	NHCOcycPr	Cl	
1-531	OMe	NHCOCHCMe ₂	Cl	
1-532	OMe	NHCOPh	Cl	
1-533	OMe	SMe	Cl	
1-534	OMe	SOMe	Cl	
1-535	OMe	SO ₂ Me	Cl	
1-536	OMe	SEt	Cl	
1-537	OMe	SOEt	Cl	
1-538	OMe	SO ₂ Et	Cl	
1-539	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-540	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-541	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-542	OEt	SMe	Cl	
1-543	OEt	SOMe	Cl	
1-544	OEt	SO ₂ Me	Cl	
1-545	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃	
1-546	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃	
1-547	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-548	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃	
1-549	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃	
1-550	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃	
1-551	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-552	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-553	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-554	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl	
1-555	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl	
1-556	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl	
1-557	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl	
1-558	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl	
1-559	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl	
1-560	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-561	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-562	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-563	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me	
1-564	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me	
1-565	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-566	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me	
1-567	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me	

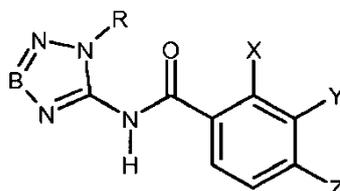
(continuación)

Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-568	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-569	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-570	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-571	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-572	OSO ₂ Me	SMe	CF ₃	11,87 (s.a., 1H), 7,98 (d,H), 7,94 (d, 1H), 4,57 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), 2,52 (s, 3H)
1-573	OSO ₂ Me	SOMe	CF ₃	
1-574	OSO ₂ Me	SO ₂ Me	CF ₃	
1-575	SMe	SMe	H	
1-576	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	
1-577	SMe	SMe	F	
1-578	SMe	SEt	F	
1-579	SO ₂ Me	NHEt	Cl	
1-580	SMe	OCH ₂ CHF ₂	Br	
1-581	SO ₂ Me	F	CF ₃	
1-582	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃	
1-583	Cl	SMe	CF ₃	11,9 (s.a., 1H), 7,98 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 4,59 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 2,45 (s, 3H)
1-584	Cl	SOMe	CF ₃	11,9 (s.a., 1H), 8,07 (s, 2H), 4,59 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 3,16 (s, 3H)
1-585	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	12,0 (s.a., 1H), 8,21 (2d, 2H), 4,59 (t, 2H), 3,78 (t, 2H), 3,54 (s, 3H), 3,24 (s, 3H)
1-586	Cl	OCHF ₂	SO ₂ Me	10,95 (s.a., 1H), 8,11 (d, 1H) 7,74 (d.a., 1H), 6,84 (t, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,28 (s, 3H)
1-587	Cl	OCHF ₂	SO ₂ Et	10,05 (s.a., 1H), 8,09 (d, 1H), 7,75 (d.a., 1H), 6,86 (t, 1H), 4,64 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,40 (q, 2H), 3,40 (s, 3H), 1,30 (t, 3H)
1-588	Me	O(CH ₂) ₂ SOEt	Br	9,41 (s.a., 1H), 7,53 (d, 1H), 7,23 (d, 1H), 4,60 (t, 2H), 4,31-4,42 (m, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,23-3,30 (m, 1H), 3,02-3,09 (m, 1H), 2,83-2,94 (m, 2H), 2,54 (s, 3H), 1,42 (t, 3H)
1-589	Me	O(CH ₂) ₂ SO ₂ Et	Br	9,58 (s.a., 1H), 7,55 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 4,62 (t, 2H), 4,35 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,50 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,29 (q, 2H), 2,53 (s, 3H), 1,48 (t, 3H)
1-590	Cl	O(CH ₂) ₂ SMe	Cl	9,71 (s.a., 1H), 7,47 (s, 2H), 4,61 (t, 2H), 4,21 (t, 2H), 3,82 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,98 (t, 2H), 2,22 (s, 3H)
1-591	Et	SEt	CF ₃	7,70 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 4,63 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,27 (q, 2H), 2,80 (q, 2H), 1,29-1,23 (m, 6H)
1-592	Et	SOEt	CF ₃	7,74 - 7,62 (m, 2H), 4,62 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,63 (m, 1H), 3,52 - 3,25 (m, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,95 (m, 1H), 1,46 (t, 3H), 1,29 (t, 3H)
1-593	Et	SO ₂ Et	CF ₃	7,91 (d, 1H), 7,76 (m, 1H), 4,61 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,50 - 3,13 (m,7H), 1,50 (t, 3H), 1,34 (t, 3H)
1-594	cPr	SOMe	CF ₃	
1-595	Et	SEt	Cl	

(continuación)

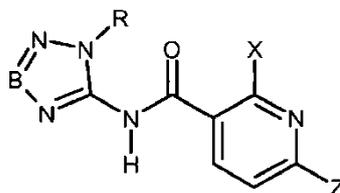
Nº	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-596	Et	SOEt	Cl	
1-597	Et	SO ₂ Et	Cl	
1-598	OMe	SMe	CHF ₂	8,21 (d, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,23 (t, 1H), 4,60 (t, 2H), 4,12 (s, 3H), 3,82 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,46 (s, 3H) en CDCl ₃
1-599	OMe	SOMe	CHF ₂	
1-600	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	
1-601	OMe	SEt	CHF ₂	
1-602	OMe	SOEt	CHF ₂	
1-603	OMe	SO ₂ Et	CHF ₂	
1-604	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	
1-605	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	
1-606	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	
1-607	CH ₂ OMe	SMe	Cl	
1-608	CH ₂ OMe	SOMe	Cl	
1-609	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Cl	
1-610	CH ₂ OMe	SEt	Cl	
1-611	CH ₂ OMe	SOEt	Cl	
1-612	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	Cl	
1-613	CH ₂ OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-614	CH ₂ OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-615	CH ₂ OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-616	CH ₂ OMe	SMe	CF ₃	
1-617	CH ₂ OMe	SOMe	CF ₃	
1-618	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	CF ₃	
1-619	CH ₂ OMe	SEt	CF ₃	
1-620	CH ₂ OMe	SOEt	CF ₃	
1-621	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	CF ₃	
1-622	CH ₂ OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-623	CH ₂ OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-624	CH ₂ OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-625	CH ₂ OMe	SMe	SO ₂ Me	
1-626	CH ₂ OMe	SOMe	SO ₂ Me	
1-627	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-628	CH ₂ OMe	SEt	SO ₂ Me	
1-629	CH ₂ OMe	SOEt	SO ₂ Me	
1-630	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-631	CH ₂ OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-632	CH ₂ OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-633	CH ₂ OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-634	Et	SEt	SO ₂ Me	
1-635	Et	SOEt	SO ₂ Me	
1-636	Et	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-637	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-638	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-639	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-640	Cl	SEt	SO ₂ Me	
1-641	Cl	SOEt	SO ₂ Me	
1-642	Cl	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-643	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-644	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-645	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-646	Cl	SEt	CF ₃	
1-647	Cl	SOEt	CF ₃	
1-648	Cl	SO ₂ Et	CF ₃	
1-649	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-650	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-651	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	

Tabla 2: Compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I), en la que A representa CY



Nº	B	R	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-1	N	(CH ₂) ₂ OH	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,81 (d,H), 7,72 (d, 1H), 4,35 (s.a., 1H), 4,15 (t, 2H), 3,72 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,74 (s, 3H)
2-2	N	(CH ₂) ₂ OEt	Me	SO ₂ Me	CF ₃	11,8 (s.a., 1H), 8,07 (d,H), 8,03 (d, 1H), 4,58 (t, 2H), 3,79 (t, 2H), 3,49 (s, 3H), 3,41 (q, 2H), 2,76 (s, 3H), 1,02 (t, 3H)
2-3	CH	(CH ₂) ₂ OMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃	
2-4	N	(CH ₂) ₂ OBn	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,90 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,34-7,21 (m, 5H), 4,52 (t, 2H), 4,47 (s, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,72 (s, 3H)
2-5	N	CH ₂ CMe ₂ OMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃	11,6 (s.a., 1H), 7,96 (d,H), 7,84 (d, 1H), 4,34 (s, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,13 (s, 3H), 2,75 (s, 3H), 1,13 (s, 6H)
2-6	N	(CH ₂) ₃ OMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,97(d, 1H), 7,92 (d, 1H), 4,30 (m, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,29 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,76 (s, 3H), 2,05 (m, 2H)
2-7	N	CH ₂ CN	Me	SO ₂ Me	CF ₃	8,15 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 5,79 (s, 2H), 3,45 (s, 3H), 2,75 (s, 3H)
2-8	N	(CH ₂) ₂ NMe ₂	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,88 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 4,27 (m, 2H), 3,71 (m, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,75 (m, 2H), 2,15 (s, 6H)
2-9	N	CH ₂ SiMe ₃	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,95-7,89 (m, 2H), 3,73 (s, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,76 (s, 3H), 0,13 (s,9H)
2-10	N	(CH ₂) ₂ SiMe ₃				
2-11	N	CH ₂ PO(OEt) ₃				
2-12	N	CH ₂ SMe				
2-13	N	(CH ₂) ₂ SMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃	11,9 (s.a., 1H), 8,06 (s, 2H), 4,58 (t, 2H), 3,44 (s, 3H), 3,02 (t, 2H), 2,76 (s, 3H), 2,07 (s, 3H)
2-14	N	(CH ₂) ₂ SOMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃	8,13 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 4,85-4,78 (m, 2H), 3,48-3,38 (m, 2H), 3,44 (s, 3H), 2,77 (s, 3H), 2,63 (s, 3H)
2-15	N	(CH ₂) ₂ SO ₂ Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	7,98 (s.a., 2H), 4,73 (t, 2H), 3,81 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,05 (s, 3H), 2,76 (s, 3H)
2-16	N	(CH ₂) ₂ CN	Me	SO ₂ Me	CF ₃	
2-17	N	(CH ₂) ₂ NO ₂	Me	SO ₂ Me	CF ₃	
2-18	N	CH ₂ (2-oxopirrolidin-1-ilo)	Me	SO ₂ Me	CF ₃	
2-19	N	CH ₂ CMeOMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃	11,71 (s.a., 1H), 8,07 (d,H), 8,00 (d, 1H), 4,54 (dd, 1H), 4,40 (dd, 1H), 3,78 (m, 1H), 3,44 (s, 3H), 3,16 (s, 3H), 2,76 (s, 3H), 1,14 (d, 3H)

Tabla 3: Compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I), en la que A representa N



Nº	B	R	X	Z	Datos físicos (RMN de ¹ H, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
3-1	CH	C ₂ H ₄ OMe	Me	CF ₃	
3-2	N	C ₂ H ₄ OMe	Me	CF ₃	10,6 (s.a., 1H), 8,17 (d, 1H), 7,68 (d,1 H), 4,69 (t, 2H), 3,85 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,84 (s, 3H)
3-3	N	C ₂ H ₄ OMe	iPr	CF ₃	
3-4	CH	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ OMe	CF ₃	
3-5	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ OMe	CF ₃	11,8 (s.a., 1H), 8,34 (d,1 H), 8,02 (d,1 H), 4,78 (s, 2H), 4,51 (t, 2H), 3,77 (t, 2H), 3,28 (s, 3H), 3,23 (s, 3H)
3-6	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ OEt	CF ₃	
3-7	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ OiPr	CF ₃	
3-8	CH	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
3-9	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
3-10	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	CF ₃	
3-11	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-12	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ OCH ₂ cPr	CF ₃	
3-13	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ (3-Me-imidazolin-2-on-1-ilo)	CF ₃	
3-14	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ (3-metoxi-4-metil-1,2,4-triazolin-5-on-1-ilo)	CF ₃	12,17 (s.a., 1H), 8,24 (d, 1H), 7,77 (d, 1H), 5,28 (s, 2H), 4,73 (t, 2H), 4,05 (s, 3H), 3,78 (t, 2H), 3,27 (s, 3H), 3,12 (s, 3H)
3-15	N	C ₂ H ₄ OMe	CH ₂ SMe	CF ₃	
3-16	CH	C ₂ H ₄ OMe	Cl	CF ₃	
3-17	N	C ₂ H ₄ OMe	Cl	CF ₃	11,99 (s.a., 1H), 8,55 (s.a., 1H), 8,20 (s.a., 1H), 4,37 (m, 2H), 3,72 (m, 2H), 2,39 (s, 3H)
3-18	N	C ₂ H ₄ OMe	Br	CF ₃	
3-19	N	C ₂ H ₄ OMe	Br	CF ₃	
3-20	N	C ₂ H ₄ OMe	SMe	CF ₃	8,37 (d,1 H), 7,62 (d,1 H), 4,59 (m, 2H), 3,78 (m, 2H), 3,23 (s, 3H),
3-21	N	C ₂ H ₄ OMe	F	F	
3-22	N	C ₂ H ₄ OMe	F	F	
3-23	CH	C ₂ H ₄ OMe	Cl	Cl	
3-24	N	C ₂ H ₄ OMe	Cl	Cl	9,95 (s.a., 1H), 8,16 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 4,61 (t, 2H), 3,83 (t, 2H), 3,39 (s, 3H)
3-25	CH	C ₂ H ₄ OMe	Me	Cl	
3-26	N	C ₂ H ₄ OMe	Me	Cl	
3-27	N	C ₂ H ₄ OMe	SMe	Cl	
3-28	N	C ₂ H ₄ OMe	SO ₂ Me	Cl	
3-29	CH	C ₂ H ₄ OMe	Cl	SMe	
3-30	N	C ₂ H ₄ OMe	Cl	SMe	
3-31	CH	C ₂ H ₄ OMe	Me	SO ₂ Me	
3-32	N	C ₂ H ₄ OMe	Me	SO ₂ Me	
3-33	N	C ₂ H ₄ OMe	SMe	SMe	
3-34	N	C ₂ H ₄ OMe	SO ₂ Me	SO ₂ Me	

B. Ejemplos de formulación

- 5 a) Se obtiene un producto para espolvorear, mezclándose 10 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y triturándose en un molino de percusión.
- b) Se obtiene un polvo humectable, fácilmente dispersable, mezclándose 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales, 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de ligninsulfonato de potasio y 1 parte en peso de oleoilmitilaurato de sodio como agente

humectante y agente de dispersión y moliéndose en un molino de clavijas.

- 5 c) Se obtiene un concentrado de dispersión fácilmente dispersable en agua, mezclándose 20 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales con 6 partes en peso de alquilfenolpoliglicol éter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanolpoliglicol éter (8 EO) y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico (intervalo de ebullición por ejemplo aproximadamente de 255 de más de 277 C) y se muele en un molino de bolas de fricción hasta una finura de por debajo de 5 micras.
- d) Se obtiene un concentrado emulsionable de 15 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales, 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxetilado como emulsionante.
- 10 e) Se obtiene un granulado dispersable en agua mezclándose 75 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales, 10 partes en peso de ligninsulfonato de calcio, 5 partes en peso de laurilsulfato de sodio, 3 partes en peso de poli(alcohol vinílico) y 7 partes en peso de caolín, se muelen en un molino de clavijas y se granula el polvo en un lecho fluidizado mediante rociado de agua como líquido de granulación.
- 15 f) Se obtiene también un granulado dispersable en agua, homogeneizándose 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales, 5 partes en peso de 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio, 2 partes en peso de oleoilmetiltaurato de sodio, 1 parte en peso de poli(alcohol vinílico), 17 partes en peso de carbonato de calcio y 50 partes en peso de agua
- 20 en un molino coloidal y se tritura previamente, a continuación se muele en un molino de perlas y se pulveriza la suspensión así obtenida en un lavador rociador por medio de una boquilla atomizadora y se seca.
- 25

C. Ejemplos biológicos

1. Efecto herbicida contra plantas nocivas en la preemergencia

30 Se plantan semillas de plantas de cultivo o malas hierbas mono- o dicotiledóneas en macetas de fibra de madera en tierras arcillosas arenosas y se cubren con tierra. Los compuestos de acuerdo con la invención formulados en forma de polvos humectables (WP) o como concentrados en emulsión (EC) se aplican entonces como emulsión o suspensión acuosa con una cantidad de aplicación de agua de alrededor de 600 a 800 l/ha con el uso del 0,2 % de agente humectante sobre la superficie de la tierra de cubrición. Tras el tratamiento se colocan las macetas en el invernadero y se mantienen en buenas condiciones de crecimiento para las plantas de prueba. La puntuación visual de los daños en las plantas de ensayo se realiza tras un tiempo de ensayo de 3 semanas en comparación con controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas han muerto, 0 % de efecto = que las plantas control). A este respecto muestran por ejemplo los compuestos N° 1-16, 1-44, 1-60, 1-125, 1-154, 1-162, 1-163, 1-174, 1-187, 1-191, 1-197, 1-200, 1-204, 1-215, 1-245, 1-246, 1-248, 1-343, 1-345, 1-361, 1-366, 1-368, 1-417, 1-450, 1-452, 1-453, 1-456, 1-458, 1-460, 1-463, 1-464, 1-465, 1-468, 1-475, 1-476, 1-488, 1-494, 1-517, 1-572, 1-583, 2-2, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-19, 3-2 y 3-16 con una cantidad de aplicación de 320 g/ha en cada caso un efecto de al menos el 90 % contra *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Matricaria inodora*, *Stellaria media*, *Veronica persica* y *Viola tricolor*.

35

40

2. Efecto herbicida contra plantas nocivas en la postemergencia

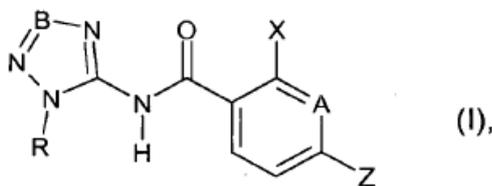
45 Se plantan semillas de plantas de cultivo o malas hierbas mono o dicotiledóneas en macetas de fibra de madera en tierras arcillosas arenosas, se cubren con tierra y se introducen en el invernadero en buenas condiciones de crecimiento. De 2 a 3 semanas tras la siembra se tratan las plantas de ensayo en el estadio de una hoja desplegada. Los compuestos de acuerdo con la invención formulados en forma de polvos humectables (WP) o como concentrados en emulsión (EC) se pulverizan entonces como emulsión o suspensión acuosa con una cantidad de aplicación de agua de alrededor de 600 a 800 l/ha con la adición del 0,2 % de agente humectante sobre las partes verdes de las plantas. Tras aproximadamente 3 semanas de tiempo de estadía de las plantas de ensayo en el invernadero en condiciones de crecimiento óptimas se valora el efecto de las preparaciones visualmente en comparación con controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas han muerto, 0 % de efecto = que las plantas control). A este respecto muestran por ejemplo los compuestos N° 1-23, 1-44, 1-125, 1-128, 1-154, 1-157, 1-162, 1-188, 1-197, 1-200, 1-215, 1-220, 1-245, 1-246, 1-344, 1-345, 1-350, 1-366, 1-368, 1-417, 1-450, 1-453, 1-456, 1-460, 1-465, 1-468, 1-475, 1-487, 1-488, 1-494, 1-517, 1-518, 1-583, 2-2, 2-4, 2-5, 2-6, 2-19, 3-2, 3-5 y 3-23 con una cantidad de aplicación de 80 g/ha en cada caso un efecto de al menos el 90 % contra *Abutilon theophrasti*, *Matricaria inodora*, *Pharbitis purpureum*, *Stellaria media*, *Veronica persica* y *Viola tricolor*.

50

55

REIVINDICACIONES

1. Amidas del ácido N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico de fórmula (I) o sus sales



en la que

5 A significa N o CY,

B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, formilo, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, estando los dos restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo,

Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-CN, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, alquil (C₁-C₆)-fenilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, estando los 6 últimos restos sustituidos en cada caso con s restos del grupo de halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

Z significa halógeno, ciano, rodano, halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, heteroarilo, heterociclilo o fenilo, estando los tres últimos restos sustituidos en cada caso con s restos del grupo de halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆) o halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo, o Z puede significar también hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxilo (C₁-C₆), en caso de que Y represente el resto S(O)_nR₂,

R significa CH₂R⁶, heterociclilo CH₂ sustituido con m grupos oxo, cicloalquilo (C₃-C₇) sustituido con t grupos alquilo (C₁-C₆), alquilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halo-alquilo (C₂-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆) o halo-alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con u restos del grupo que consiste en nitro, ciano, hidroxilo, oxo, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, OCOOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, estando los restos cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo sustituidos en cada caso con s sustituyentes del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxilo, ciano, nitro, trifluorometilo y halógeno, y portando heterociclilo y cicloalquilo n grupos oxo,

Q significa O, S o NR³,

R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo,

50

- heterociclo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, estando sustituidos los 21 restos mencionados en último lugar con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, rodano, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₂-C₆)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 5 R² significa alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo estando sustituidos los 21 restos mencionados en último lugar con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, rodano, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₂-C₆)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 10 R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆),
- 15 R⁴ significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆),
- R⁵ significa alquilo (C₁-C₄),
- R⁶ significa OCOOR⁴, NR⁴COOR⁴, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, heterociclilo o cicloalquilo, portando los dos restos mencionados en último lugar m grupos oxo o hidroxilo,
- 20 m significa 1 o 2,
n significa 0, 1 o 2,
s significa 0, 1, 2 o 3,
t significa 1, 2, 3 o 4,
u significa 1, 2, 3, 4 o 5.
- 25 2. Amidas del ácido N-(triazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico de acuerdo con la reivindicación 1, en las que
- A significa N o CY,
B significa N o CH,
- X significa nitro, halógeno, ciano, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹ o alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, estando los dos restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 30 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, rodano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, COOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquil (C₁-C₆)-fenilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, estando los seis restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos del grupo de halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 40 Z significa halógeno, ciano, rodano, halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, C(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-OCOR¹, alquil (C₁-C₆)-OSO₂R², alquil (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquil (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², 1,2,4-triazol-1-ilo, o
- 45 Z puede significar también hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxilo (C₁-C₆), en caso de que Y represente el resto S(O)_nR₂,
- 50 R significa CH₂R⁶,
- 55

- heterociclilo CH₂ sustituido con m grupos oxo, alquilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halo-alquilo (C₂-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o halo-alquino (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con u restos del grupo que consiste en nitro, ciano, hidroxilo, oxo, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, estando sustituidos los restos cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo en cada caso con s sustituyentes del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxilo, ciano, nitro, trifluorometilo y halógeno, y portando heterociclilo y cicloalquilo n grupos oxo,
- Q significa O, S o NR³,
- 10 R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, estando los 16 restos mencionados en último lugar sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₂-C₆)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 15 R² significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquil (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquil (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, estando estos restos sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, NR³SO₂R⁴, COR³, OCOR³, NR³COR³, CO₂R³, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₂-C₆)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 20 R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆),
- R⁴ significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆),
- 25 R⁵ significa metilo o etilo,
- R⁶ significa OCOOR⁴, NR⁴COOR⁴, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂ o heterociclilo, que porta m grupos oxo,
- m significa 1 o 2,
n significa 0, 1 o 2,
30 s significa 0, 1, 2 o 3,
u significa 1, 2, 3, 4 o 5.
3. Amidas del ácido N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2, en las que
- A significa N o CY,
- 35 B significa N o CH,
- X significa nitro, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), OR¹, S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, estando los dos restos mencionados en último lugar sustituidos en cada caso con s restos halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 40 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), OR¹, S(O)_nR², SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquil (C₁-C₆)-OR¹, alquil (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquil (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquil (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquil (C₁-C₆)-fenilo, alquil (C₁-C₆)-heteroarilo, alquil (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, estando los 6 últimos restos sustituidos en cada caso con s restos del grupo de halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,
- 45 Z significa halógeno, ciano, halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_nR², 1,2,4-triazol-1-ilo, o Z puede significar también hidrógeno, metilo, metoxilo o etoxilo, en caso de que Y represente el resto S(O)_nR²,
- 50 R significa CH₂R⁶,
CH₂-heterociclilo, portando heterociclilo m grupos oxo,
alquilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halo-alquilo (C₂-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o halo-alquino (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con u restos del grupo que consiste en nitro, ciano, hidroxilo, oxo, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxilo (C₁-C₆), halo-alcoxilo (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, OCOR³, NR³COR³,

$\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, estando sustituidos los restos cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo en cada caso con s sustituyentes del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxilo, ciano, nitro, trifluorometilo y halógeno, y portando heterociclilo y cicloalquilo n grupos oxo,

5 Q significa O, S o NR^3 ,

R^1 significa hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), fenilo, fenil-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heteroarilo, heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heteroarilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heterociclilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heteroarilo o alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heterociclilo, estando los 16 restos mencionados en último lugar sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR^3 , $\text{S(O)}_n\text{R}^4$, $\text{N(R}^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, CO_2R^3 , $\text{CON(R}^3)_2$ y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_2\text{-C}_6$)-carbonilo, y portando heterociclilo n grupos oxo,

R^2 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$) o cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), estando estos tres restos mencionados anteriormente sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en halógeno y OR^3 ,

R^3 significa hidrógeno o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$),

15 R^4 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$),

R^5 significa metilo o etilo,

R^6 significa OCOOR^4 , NR^4COOR^4 , S(O)_n -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), S(O)_n -haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), nitro, ciano, SiR^5_3 , $\text{PO(OR}^5)_2$,

20 m significa 1 o 2,

n significa 0, 1 o 2,

s significa 0, 1, 2 o 3,

u significa 1, 2, 3, 4 o 5.

4. Agentes herbicidas, caracterizados por un contenido de acción herbicida en al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3.

25 5. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 4 en mezcla con agentes auxiliares de formulación.

6. Agentes herbicidas de acuerdo con las reivindicaciones 4 o 5 que contienen al menos una sustancia de acción pesticida adicional del grupo de insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores del crecimiento.

7. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 6 que contienen un protector selectivo.

30 8. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 7 que contienen cipsulfamida, cloquintocet-mexilo, mefenpir-dietilo o isoxadifen-etilo.

9. Agentes herbicidas de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 a 8 que contienen un herbicida adicional.

35 10. Procedimiento para combatir plantas indeseadas, caracterizado porque se aplica una cantidad efectiva de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 o de un agente herbicida de acuerdo con una de las reivindicaciones 4 a 9 sobre las plantas o sobre el sitio del crecimiento de plantas indeseado.

11. Uso de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 o de agentes herbicidas de acuerdo con una de las reivindicaciones 4 a 9 para combatir plantas indeseadas.

12. Uso de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizado porque los compuestos de fórmula (I) se usan para combatir plantas indeseadas en cultivos de plantas útiles.

40 13. Uso de acuerdo con la reivindicación 12, caracterizado porque las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.