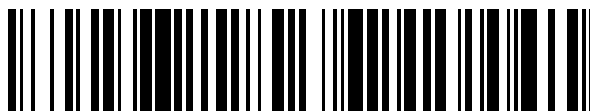


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 747 753**

51 Int. Cl.:

**C07D 413/12** (2006.01)

**C07D 417/12** (2006.01)

**C07D 271/113** (2006.01)

**A01N 43/82** (2006.01)

**A01N 43/84** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **29.06.2016 PCT/EP2016/065091**

87 Fecha y número de publicación internacional: **12.01.2017 WO17005564**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **29.06.2016 E 16732670 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.07.2019 EP 3317272**

54 Título: **Derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida con acción herbicida**

30 Prioridad:

**03.07.2015 EP 15175277**

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

**11.03.2020**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT  
(100.0%)  
Alfred-Nobel-Strasse 50  
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**KÖHN, ARNIM;  
WALDRAFF, CHRISTIAN;  
AHRENS, HARTMUT;  
HEINEMANN, INES;  
BRAUN, RALF;  
DIETRICH, HANSJÖRG;  
ROSINGER, CHRISTOPHER HUGH y  
GATZWEILER, ELMAR**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

ES 2 747 753 T3

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

## DESCRIPCIÓN

Derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida con acción herbicida

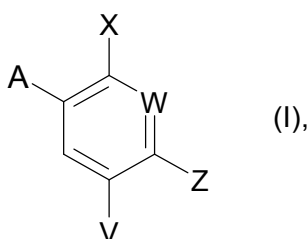
La invención se refiere al campo técnico de los herbicidas, especialmente al de los herbicidas para el control selectivo de malezas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles.

5 Las N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamidas se conocen como herbicidas por el documento WO 2012/126932 A1. El documento WO 2013/087577 A1 divulga también como herbicidas las N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamidas que están sustituidas en el nitrógeno de amida. Las carboxamidas de triazinona con acción herbicida, que están sustituidas en el nitrógeno de amida se conocen por el documento WO 2014/126070 A1.

10 Fue un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos con acción herbicida con propiedades mejoradas con respecto a las de los compuestos conocidos por el estado de la técnica.

Se ha encontrado que ciertos derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida, que están sustituidos con restos específicos en el resto oxadiazolilo o en el grupo carbamóilo, son particularmente adecuados como herbicidas.

De esta manera, un objeto de la presente invención son derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida de la fórmula (I)



15

en la que los símbolos y los índices tienen los siguientes significados:

W significa N o CY,

20 X y Z significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, formilo, tiocianato, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), COR<sup>1</sup>, OR<sup>1</sup>, OCOR<sup>1</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OCOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>, P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, o

25 heteroarilo, heterociclilo o fenilo sustituido en cada caso con s restos del grupo metilo, etilo, metoxilo, nitro, trifluorometilo y halógeno,

30 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquenilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), COR<sup>1</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, OCO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, OC(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C(O)N(R<sup>1</sup>)OR<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, OR<sup>1</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OCOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CN, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-N=C(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-fenilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en los que los 6 restos mencionados en último lugar están sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), S(O)<sub>n</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y cianometilo, y en los que heterociclilo porta n grupos oxo,

40 o

Y y Z junto con los dos átomos a los que están unidos forman un anillo de 5, 6 o 7 miembros, insaturado, parcialmente saturado o saturado que, además de átomos de carbono, en cada caso, comprende s átomos de nitrógeno, n átomos de oxígeno, n átomos de azufre y n elementos S(O), S(O)<sub>2</sub>, C=N-R<sup>8</sup>, C(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C[-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-] o C(O) como miembros del anillo,

45 cuyos átomos de carbono están sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenoxi, halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alquilo y fenilo, cuyos átomos de nitrógeno están sustituidos en cada caso con n restos del grupo que consiste en alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y fenilo, y en los que los restos fenilo mencionados anteriormente están sustituidos en cada caso con s restos del grupo

que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),

V significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o OR<sup>1</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>,

R<sup>1</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalqueno (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heterociclilo, en los que los 21 restos mencionados en último lugar están sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR<sup>3</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>, N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup>OR<sup>3</sup>, COR<sup>3</sup>, OCOR<sup>3</sup>, SCOR<sup>4</sup>, NR<sup>3</sup>COR<sup>3</sup>, NR<sup>3</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>, COSR<sup>4</sup>, CON(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub> y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-carbonilo, y en los que heterociclilo n grupos oxo,

R<sup>2</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalqueno (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heterociclilo, en los que los 21 restos mencionados en último lugar están sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR<sup>3</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>, N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup>OR<sup>3</sup>, COR<sup>3</sup>, OCOR<sup>3</sup>, SCOR<sup>4</sup>, NR<sup>3</sup>COR<sup>3</sup>, NR<sup>3</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>, COSR<sup>4</sup>, CON(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub> y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-carbonilo, y en los que heterociclilo n grupos oxo,

R<sup>3</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),

R<sup>4</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) o alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),

R<sup>5</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

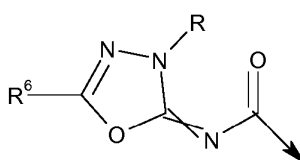
n significa 0, 1 o 2,

s significa 0, 1, 2 o 3,

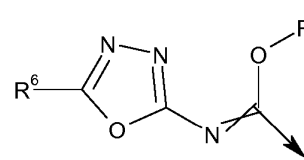
A significa un resto A1, A2, o A3



A1



A2



A3

R significa alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OC(O)N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub> o alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OC(O)OR<sup>10</sup>,

R<sup>6</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>1</sup>O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CH<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), OR<sup>1</sup>, NHR<sup>1</sup>, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, metilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, dimetilamino, acetilamino, metilsulfenilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo o heteroarilo, heterociclilo, bencilo o fenilo sustituidos en cada caso con s restos del grupo halógeno, nitro, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), S(O)<sub>n</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

R<sup>7</sup> significa acetoxi, acetamido, N-metilacetamido, benzoiloxi, benzamido, N-metilbenzamido, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, benzoílo, metilcarbonilo, piperidinilcarbonilo, morfolinilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, aminocarbonilo, metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) o heteroarilo, heterociclilo o fenilo en cada caso sustituidos con s restos del grupo metilo, etilo, metoxilo, trifluorometilo y halógeno,

R<sup>8</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o halógeno-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxilo,

R<sup>9</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),

R<sup>10</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>).

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

R<sup>6</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>1</sup>O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),

y los otros sustituyentes e índices tienen los significados mencionados anteriormente.

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

W significa CY,

5 X y Z significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), OR<sup>1</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, o heteroarilo, heterociclilo o fenilo sustituido en cada caso con s restos del grupo metilo, etilo, metoxilo, nitro, trifluorometilo y halógeno,

10 Y significa hidrógeno, alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), COR<sup>1</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, OCO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, OC(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C(O)N(R<sup>1</sup>)OR<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, OR<sup>1</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OCOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, heteroarilo o heterociclilo, en los que los 4 restos mencionados en último lugar están sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), S(O)<sub>n</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y cianometilo, y en los que heterociclilo porta n grupos oxo,

15 V significa hidrógeno, Cl, OMe, metilo o etilo,

R<sup>6</sup> significa metilo, etilo, metoximetilo o metoxietilo,

y los otros sustituyentes e índices tienen los significados mencionados anteriormente.

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

X significa F, Cl, Br, metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo, metoxilo, metoximetilo, metoxietoximetilo, SMe o SO<sub>2</sub>Me,

Z significa hidrógeno, F, Cl, Br, I, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, pentafluoroetilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo,

25 Y significa hidrógeno, SMe, S(O)Me, SO<sub>2</sub>Me, SEt, S(O)Et, SO<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>OEt, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, ,CH<sub>2</sub>SMe, CH<sub>2</sub>S(O)Me, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me, vinilo, C(O)Me, C(O)Et, C(O)cPr, CO<sub>2</sub>Me, CHN=OMe, 4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 5-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 5-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 5-cianometil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo, 3-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo, 1H-pirazol-1-ilo, 1H-1,2,3-triazol-1-ilo, 2H-1,2,3-triazol-2-ilo, 1H-1,2,4-triazol-1-ilo, pirrolidin-2-on-1-ilo, morfolin-3-on-4-ilo, OMe, OEt, OnPr, OCH<sub>2</sub>cPr, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe o OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe,

30 V significa hidrógeno,

R significa CH<sub>2</sub>OCO<sub>2</sub>Et, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>Me, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>Et, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>-c-hexilo, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>-i-Pr o CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>-t-Bu,

R<sup>6</sup> significa metilo,

35 y los otros sustituyentes e índices tienen los significados mencionados anteriormente.

En la fórmula (I) y en todas las fórmulas que siguen, los restos alquilo que tienen más de dos átomos de carbono pueden ser de cadena recta o ramificados. Los restos alquilo son, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo o isopropilo, n-, iso-, t- o 2-butilo, pentilos, hexilos tales como n-hexilo, isohexilo y 1,3-dimetilbutilo. De manera análoga, el alqueno es, por ejemplo, alilo, 1-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metilbut-3-en-1-ilo y 1-metilbut-2-en-1-ilo. El alquinilo es, por ejemplo, propargilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 1-metilbut-3-in-1-ilo. La unión múltiple puede ser en cualquier posición en cada resto no sustituido. El cicloalquilo es un sistema anular saturado carbocíclico que tiene tres a seis átomos de carbono, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo. De manera análoga, el cicloalqueno es un grupo alqueno monocíclico que tiene tres a seis miembros anulares de carbono, por ejemplo, ciclopropenilo, ciclobutenilo, ciclohexenilo y ciclohexenilo, donde la unión doble puede estar en cualquier posición.

Halógeno representa flúor, cloro, bromo o yodo.

El heterociclilo significa un resto cíclico saturado, parcialmente saturado o totalmente insaturado que contiene 3 a 6 átomos en el anillo, de los cuales 1 a 4 son del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre, y que pueden fusionarse además mediante un anillo benzo. Por ejemplo, el heterociclilo es piperidinilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo y oxetanilo.

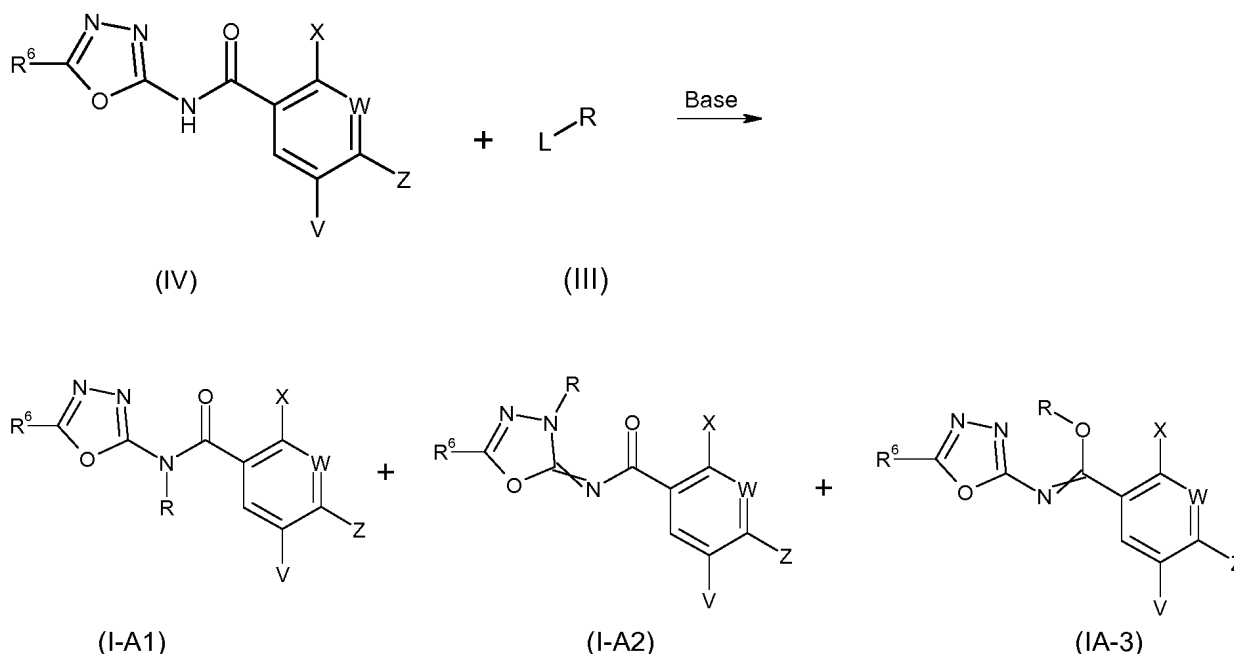
El heteroarilo significa un resto cíclico aromático que contiene 3 a 6 átomos en el anillo, de los cuales 1 a 4 son del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre, y que pueden fusionarse además mediante un anillo benzo. Por ejemplo, el heteroarilo es bencimidazol-2-ilo, furanilo, imidazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, piridinilo, bencisoxazolilo, tiazolilo, pirrolilo, 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 y 1,2,3,5-tiatrizolilo.

Si un grupo está polisustituido mediante restos, debe comprenderse que significa que ese grupo está sustituido por uno o más restos idénticos o diferentes seleccionados de los restos mencionados. Lo mismo aplica a la formación de sistemas anulares mediante diferentes átomos y elementos.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes y el modo en el cual se adhieren, los compuestos de la fórmula general (I) pueden estar presentes como estereoisómeros. Si, por ejemplo, uno o más átomos de carbono asimétrico se encuentran presentes, pueden ocurrir enantiómeros y diastereómeros. Los estereoisómeros, del mismo modo, ocurren cuando n es 1 (sulfóxidos). Los estereoisómeros pueden obtenerse de mezclas obtenidas en la preparación mediante procedimientos de separación habituales, por ejemplo, mediante procedimientos de separación cromatográfica. Del mismo modo es posible preparar selectivamente los estereoisómeros mediante la utilización de reacciones estereoselectivas con el uso de materiales de partida ópticamente activos y/o auxiliares. La invención también se refiere a todos los estereoisómeros y mezclas de los anteriores que se abarcan con la fórmula general (I) pero no se definen de manera específica. Debido a la estructura de éter de oxima, los compuestos de acuerdo con la invención pueden ocurrir también como isómeros geométricos (isómeros E/Z). La invención también se refiere a todos los isómeros E/Z y mezclas de los anteriores los cuales se abarcan con la fórmula general (I) pero no se definen de manera específica.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse, por ejemplo, mediante el procedimiento que se muestra en el esquema 1, mediante la reacción de una N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida (IV) con un compuesto de la fórmula general (III), donde L es un grupo saliente, por ejemplo un cloro, bromo, yodo, mesiloxi, tosiloxi, trifluorosulfoniloxi, etc.

Esquema 1



Los compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) se obtienen en principio como una mezcla de los compuestos de las fórmulas (I-A1), (I-A2) y (I-A3) y pueden aislarse mediante procedimientos simples conocidos para aquellos con experiencia en el arte tales como la separación cromatográfica o recristalización.

Las N-(1,3,4-oxadiazol-3-il)arilcarboxamidas de la fórmula (IV) se conocen en principio y pueden prepararse mediante los procedimientos descritos en el documento WO 2012/126932 A1. Los compuestos de la fórmula (III) en los que L es un grupo saliente tal como cloro, bromo, yodo, metilsulfoniloxi, tosiloxi o trifluorosulfoniloxi se encuentran disponibles en el mercado o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos descritos en la literatura.

Los grupos de compuestos de la fórmula (I) que pueden sintetizarse mediante las reacciones mencionadas con anterioridad también pueden prepararse en paralelo, en cuyo caso esto puede lograrse en un modo manual, parcialmente automático o totalmente automático. Si es posible, por ejemplo, automatizar la conducción de la reacción, el procesamiento o la purificación de los productos y/o los intermediarios. En general, se entiende que esto significa un procedimiento como se describe, por ejemplo, a través de D. Tiebes in Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor: Günther Jung), Wiley, 1999, en las páginas 1 a 34.

Para la conducción en paralelo de la reacción y el procesamiento, es posible usar una cantidad de instrumentos disponibles en el mercado, por ejemplo, los bloques de reacción Calypso de Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EE. UU. o las estaciones de reacción de Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, Inglaterra, o MultiPROBE Automated Workstations de Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, EE. UU. Para la purificación en paralelo de los compuestos de la fórmula general (I) o de los intermediarios que ocurren en el

transcurso de la preparación, los aparatos disponibles incluyen aparatos para cromatografía, por ejemplo, de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE. UU.

5 Los aparatos detallados conducen a un procedimiento modular en el cual las etapas de procesamiento son automáticas, pero tienen que llevarse a cabo operaciones manuales entre las etapas de procesamiento. Esto puede evitarse mediante la utilización de sistemas de automatización total o parcialmente integrados en los que se operan los módulos de automatización respectivos, por ejemplo, mediante robots. Los sistemas de automatización de este tipo pueden obtenerse, por ejemplo, a partir de Caliper, Hopkinton, MA 01748, EE. UU.

10 La implementación de etapas de síntesis individuales o múltiples puede justificarse mediante el uso de resinas depuradoras /reactivos soportados por polímero. La literatura especializada describe una serie de protocolos experimentales, por ejemplo, en ChemFiles, Vol. 4, N.º 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

15 Además de los procedimientos descritos en este documento, la preparación de los compuestos de fórmula general (I) puede tener lugar completa o parcialmente mediante procedimientos soportados en fase sólida. Para este fin, los intermediarios individuales o todos los intermediarios en la síntesis o una síntesis adaptada para el correspondiente procedimiento se adhieren a una resina de síntesis. Los procedimientos de síntesis soportados en fase sólida se describen de manera adecuada en la literatura técnica, por ejemplo Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998 and Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor: Günther Jung), Wiley, 1999. El uso de los procedimientos de síntesis soportados en fase sólida permite un número de protocolos, que se conocen de la literatura y que por su parte pueden realizarse manualmente o de manera automática. Las reacciones pueden realizarse, por ejemplo, por medio de la tecnología IRORI en micro-reactores de Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EE. UU.

20 Tanto en la fase sólida como líquida, la implementación de etapas de síntesis individuales o varias puede avalarse mediante la utilización de tecnología de microondas. La literatura especializada describe una serie de protocolos experimentales, por ejemplo, en Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor: C. O. Kappe and A. Stadler), Wiley, 2005.

25 La preparación de los procedimientos descritos en este documento da compuestos de la fórmula (I) en forma de conjuntos de sustancias, que se llaman bibliotecas. Son objeto de la presente invención también bibliotecas que contienen al menos dos compuestos de la fórmula (I).

30 Los compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) mencionados aquí más abajo como "compuestos de acuerdo con la invención", tienen una excelente efectividad como herbicida contra un amplio espectro de malezas anuales mono- y dicotiledóneas importantes. Los principios activos también tienen un buen control sobre plantas nocivas perennes que son difíciles de controlar y producen brotes de rizomas, raíces y otros órganos perennes.

35 Es objeto de la presente invención también, por lo tanto, un procedimiento para controlar plantas indeseadas o para regular el crecimiento de las plantas, preferentemente en plantas de cultivo, en las cuales uno o más compuesto(s) de la invención se aplica/n a las plantas (por ejemplo a las plantas dañinas tales como malezas monocotiledóneas o dicotiledóneas o a plantas de cultivo), a la semilla (por ejemplo granos, semillas o propágulos vegetativos tales como tubérculos o partes de los brotes con gajos) o al área sobre la cual crecen las plantas (por ejemplo, el área de cultivo). Los compuestos de acuerdo con la invención pueden desplegarse, por ejemplo, antes de sembrar (si corresponde también mediante la incorporación en el suelo), previo a la emergencia o después de la emergencia. 40 Los ejemplos específicos de algunos representantes de la flora de malezas monocotiledóneas o dicotiledóneas que pueden controlarse mediante los compuestos de acuerdo con la invención son los siguientes, aunque la enumeración no pretende imponer una restricción a las especies particulares.

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

50 Malezas 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, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

55 Si los compuestos de acuerdo con la invención se aplican a la superficie del suelo antes de la germinación, o bien se evita completamente la emergencia de plantines de malezas o las malezas crecen hasta que han alcanzado la etapa de cotiledón, pero dejan de crecer y finalmente mueren completamente después de que han transcurrido tres a cuatro semanas.

Si los compuestos activos se aplican después de la emergencia a las partes verdes de las plantas, el crecimiento se

detiene después del tratamiento, y las plantas dañinas permanecen en la etapa de crecimiento del momento de aplicación, o mueren completamente después de cierto tiempo, de modo que de esta manera se elimina muy anticipadamente y de un modo sostenido la competencia de las malezas, que es dañina para las plantas de cultivo.

5 Aunque los compuestos de acuerdo con la invención tienen actividad herbicida excepcional contra las malezas monocotiledóneas o dicotiledóneas, las plantas de cultivo de cultivos importantes desde el punto de vista económico, por ejemplo los 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*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, en particular *Zea* y *Triticum*, se dañarán solo hasta un grado insignificante, si ocurre, dependiendo de la estructura del compuesto particular de la invención y su tasa de aplicación. Por estos motivos, los presentes compuestos son muy apropiados para el control selectivo del crecimiento de plantas indeseables en cultivos de plantas tales como las plantas útiles para uso agrícola o plantas ornamentales.

15 Además, los compuestos de acuerdo con la invención (dependiendo de su estructura particular y la tasa de aplicación desplegada) tienen propiedades excepcionales de regulación del crecimiento en plantas de cultivo. Intervienen en el metabolismo propio de la planta con efecto regulatorio, y pueden de este modo usarse para influir de manera controlada en los constituyentes de la planta y facilitar la cosecha, por ejemplo, al desencadenar la disecación y detener el crecimiento. Además, también son adecuados para el control general y la inhibición del crecimiento vegetativo indeseado sin matar las plantas en el procedimiento. La inhibición del crecimiento vegetativo cumple una función importante para muchos cultivos de monocotiledóneas y dicotiledóneas ya que, por ejemplo, esto puede reducir o evitar completamente el atascamiento.

20 En virtud de sus propiedades herbicidas y regulatorias del crecimiento de las plantas, los compuestos activos también pueden usarse para controlar las plantas dañinas en cultivos de plantas genéticamente modificadas o plantas modificadas mediante mutagénesis convencional. En general, las plantas transgénicas se caracterizan por propiedades ventajosas particulares, por ejemplo, por las resistencias a ciertos plaguicidas, en particular a ciertos herbicidas, resistencias a las enfermedades de la planta o a patógenos de las enfermedades en la planta, tales como ciertos insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, a la calidad, a la capacidad de almacenamiento, a la composición y a los constituyentes específicos. Por ejemplo, existen plantas transgénicas conocidas con un contenido de almidón elevado o calidad de almidón alterada, o aquellos con una composición de diferente de ácidos grasos en el material cosechado.

25 Es preferible, con respecto a los cultivos transgénicos, usar los compuestos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos importantes para la economía de plantas y ornamentales útiles, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo/sorgo, arroz, maíz, o bien cultivos de remolacha, algodón, soja, colza, papa, tomate, arvejas y otros tipos de verduras. Se prefiere emplear los compuestos de acuerdo con la invención como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes, o se han hecho resistentes mediante ingeniería genética, a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

30 Se prefiere usar los compuestos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos importantes para la economía de plantas y ornamentales útiles, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo/sorgo, arroz, mandioca, maíz, o bien cultivos de remolacha, algodón, soja, colza, papa, tomate, arvejas y otras verduras. Preferentemente, los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes, o se han hecho resistentes mediante ingeniería genética, a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

35 Los modos convencionales para producir novedosas plantas que tienen propiedades modificadas en comparación con las plantas existentes consisten, por ejemplo, en los procedimientos de cultivo tradicionales y la generación de mutantes. Alternativamente, novedosas plantas con propiedades modificadas pueden generarse con la ayuda de procedimientos recombinantes (véase, por ejemplo, las patentes EP-A-0221044, EP-A-0131624). Por ejemplo, se han presentado descripciones en varios casos de:

- 40 - modificaciones genéticas de plantas de cultivo con el objetivo de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, las publicaciones WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),
- 45 - plantas de cultivo transgénico que son resistentes a los herbicidas particulares del tipo del glufosinato (véase, por ejemplo, las patentes EP-A-0242236, EP-A-242246) o el tipo glifosato (WO 92/00377) o tipo sulfonilurea (EP-A-0257993, US-A-5013659),
- 50 - plantas de cultivo transgénico, por ejemplo, algodón, capaz de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt), que hacen las plantas resistentes a plagas particulares (EP-A-0142924, EP-A-0193259),
- 55 - plantas de cultivo transgénico con una composición de ácido graso modificado (WO 91/13972),
- plantas de cultivo genéticamente modificado con novedosos constituyentes o metabolitos secundarios, por ejemplo, novedosas fitoalexinas, que traen aparejado un aumento en la resistencia a las enfermedades (EPA 309862, EPA0464461)
- 60 - plantas genéticamente modificadas que tienen fosfo-respiración reducida, que tienen rendimientos más altos y

- mayor tolerancia al estrés (EPA 0305398),
- plantas de cultivo transgénico que producen proteínas importantes para uso farmacéutico o para diagnóstico ("cultivo molecular"),
- plantas de cultivo transgénico que caracterizan mayores rendimientos o mejor calidad,
- 5 - plantas de cultivo transgénico que caracterizan, por ejemplo, las novedosas propiedades mencionadas con anterioridad ("apilamiento de genes") a través de las combinaciones.

Numerosas técnicas de biología molecular que pueden usarse para producir las plantas transgénicas con propiedades modificadas se conocen en principio; 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 dichas manipulaciones recombinantes, las moléculas de ácido nucleico que permiten mutagénesis o alteración de secuencia por recombinación de las secuencias de ADN pueden introducirse en los plásmidos. Con la ayuda de los procedimientos estándar, es posible, por ejemplo, emprender intercambios de bases, retirar partes de secuencias o agregar secuencias naturales o sintéticas. Para unir los fragmentos de ADN entre sí, pueden colocarse adaptadores o ligadores sobre los fragmentos; véase, por ejemplo, Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2ª edición Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene und Klone" [Genes and clones]", VCH Weinheim 2ª edición 1996.

Por ejemplo, la generación de células vegetales con una actividad reducida de un producto génico puede lograrse mediante la expresión en al menos un ARN antisentido correspondiente, un ARN sentido para lograr un efecto de co-supresión, o mediante la expresión de al menos un ribozima construido de manera apropiada con transcripciones de escisiones específicas del producto génico mencionado con anterioridad. Hasta este punto, es posible en primera instancia usar las moléculas de ADN que abarcan la secuencia de codificación entera de un producto génico que incluye cualquier secuencia flanqueante que pueda estar presente, y también las moléculas de ADN que solamente abarcan porciones de la secuencia de codificación, en cuyo caso es necesario que estas porciones sean lo suficientemente extensas para tener un efecto antisentido en las células. También es posible usar secuencias de ADN que tienen un alto grado de homología con las secuencias de codifican un producto génico, pero no son completamente idénticas a ellos.

Cuando se expresan las moléculas de ácido nucleico en las plantas, la proteína sintetizada puede localizarse en cualquier compartimento deseado de la célula vegetal. Sin embargo, para lograr la localización en un compartimento particular, es posible, por ejemplo, unir la región de codificación con las secuencias de ADN que aseguran la localización en un compartimento particular. Dichas secuencias son conocidas para aquellos con experiencia en el arte (véase, por ejemplo, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). Las moléculas de ácido nucleico también pueden expresarse en los orgánulos de las células de las plantas.

Las células de las plantas transgénicas pueden regenerarse mediante técnicas conocidas para dar lugar a plantas enteras. En principio, las plantas transgénicas pueden ser plantas de cualquier especie de planta deseada, es decir, no solamente monocotiledóneas sino también dicotiledóneas.

De esta manera, las plantas transgénicas pueden obtenerse cuyas propiedades se alteran por sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias génicas homólogos (naturales) o expresión de genes o secuencias génicas heterólogas (extrañas).

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse con preferencia en cultivos transgénicos que son resistentes a los reguladores del crecimiento, por ejemplo dicamba, o a los herbicidas que inhiben las enzimas esenciales de las plantas, por ejemplo, acetolactato sintasas (ALS), EPSP sintasas, glutamina sintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD), o a los herbicidas del grupo de las sulfonilureas, los glifosatos, los glufosinatos o los benzolisoxazoles y los principios activos análogos.

Cuando los compuestos de acuerdo con la invención se emplean en cultivos transgénicos, no solamente ocurren los efectos hacia las plantas dañinas observados en otros cultivos, sino también con frecuencia los efectos que son específicos para la aplicación en el cultivo transgénico particular, por ejemplo, un espectro alterado o específicamente ampliado de malezas que pueden controlarse, índices de aplicación alterados que pueden usarse para la aplicación, preferentemente buena capacidad de combinación con los herbicidas a los cuales el cultivo transgénico es resistente, y lo que influye en el crecimiento y en el rendimiento de las plantas de cultivo transgénicas.

Es objeto de la invención también, por lo tanto, el uso de los compuestos de acuerdo con la invención como herbicidas para el control de las plantas dañinas en las plantas de cultivo transgénicas.

Una ventaja adicional de los compuestos de acuerdo con la invención consiste también en una toxicidad inferior hacia organismos tales como insectos, anfibios, peces y mamíferos.

Los compuestos de acuerdo con la invención también pueden aplicarse en forma de polvos humectables,



concentrados emulsionables, soluciones espolvoreables, polvos volátiles o gránulos en las formulaciones habituales. Son objeto de la invención, por lo tanto, también composiciones herbicidas y reguladoras del crecimiento de las plantas que contienen los compuestos de acuerdo con la invención.

5 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden formularse en varios modos, de acuerdo con los parámetros biológicos y/o fisicoquímicos requeridos. Las posibles formulaciones incluyen, por ejemplo: polvos humectables (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones de aceite en agua y emulsiones de agua en aceite, soluciones espolvoreables, concentrados en suspensión (SC), dispersiones a base de aceite o agua, soluciones miscibles en aceite, suspensiones en cápsulas (CS), productos volátiles (DP), rellenos, gránulos para difracción y aplicación a selo, gránulos (GR) en forma de microgránulos, gránulos para aspersion, gránulos para absorción y adsorción, gránulos dispersables en agua (WG), gránulos solubles en agua (SG), formulaciones ULV, microcápsulas y ceras.

10 Estos tipos de formulación individual se conocen en principio y se describen, por ejemplo, en Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª Ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Los auxiliares de formulación requeridos, tales como los materiales inertes, los tensioactivos, los disolventes y aditivos adicionales, son conocidos del mismo modo 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, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Engineering], volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª Ed. 1986.

20

25 Sobre la base de estas formulaciones, también es posible producir combinaciones con otros principios activos plaguicidas, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, y también con protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo, en forma de una formulación terminada o como mezcla en tanque. Los protectores adecuados son, por ejemplo, mepfenpir-dietilo, cipsulfamida, isoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo y diclorimid.

30 Los polvos humectables son preparaciones que pueden dispersarse de manera uniforme en agua y, además del compuesto activo, aparte de un diluyente o una sustancia inerte, también comprenden tensioactivos del tipo iónico y/o no iónico (agentes humectantes, dispersantes), por ejemplo alquifenoles polioxielados, alcoholes grasos polioxielados, aminas grasas polioxieladas, poliglicol éter sulfatos de alcohol graso, acansulfonatos, alquilbencensulfonatos, lignosulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio, dibutilnaftalensulfonato de sodio o bien oleoilmetiltaurato de sodio. Para producir los polvos humectables, los principios activos herbicidas se muelen finamente, por ejemplo, en aparatos habituales tales como molinos de martillo, molinos sopladores y molinos de chorro de aire, y se mezclan simultáneamente o posteriormente con auxiliares de formulación.

35

Los concentrados emulsionables se producen por disolución del compuesto activo en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o bien aromáticos de punto de ebullición relativamente alto o hidrocarburos o mezclas de los disolventes orgánicos con la incorporación de uno o más tensioactivos (emulsionantes) iónicos y/o no iónicos. Los ejemplos de emulsionantes que pueden usarse son: alquilarilsulfonatos de calcio tales como dodecilbencensulfonato de calcio, o emulsionantes no iónicos tales como ésteres poliglicólicos del ácido graso, alquilaril poliglicol éteres, éteres poliglicólicos del alcohol graso, productos de la condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, alquil poliéteres, ésteres sorbitanos, por ejemplo, ésteres del ácido graso sorbitano, o ésteres sorbitanos de polioxielileno, por ejemplo, ésteres del ácido graso sorbitano de polioxielileno.

40

45

Los productos volátiles se obtienen mediante molienda del compuesto activo con sólidos distribuidos finamente, por ejemplo, talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierra diatomácea.

Los concentrados en suspensión pueden ser a base de agua o de aceite. Pueden prepararse, por ejemplo, mediante la molienda en húmedo por medio de molinos de perlas comerciales y la incorporación opcional de tensioactivos como ya se han enumerado, por ejemplo, más arriba para otros tipos de formulación.

50

Las emulsiones, por ejemplo, las emulsiones de aceite en agua (EW), pueden producirse, por ejemplo, por medio de agitadores, molinos coloides y/o mezcladores estáticos con el uso de disolventes orgánicos acuosos y opcionalmente tensioactivos como ya se mencionó con anterioridad, por ejemplo, para otros tipos de formulación.

Los gránulos pueden producirse indistintamente mediante la aspersion del compuesto activo sobre material inerte granulado absorbente o mediante la aplicación de los concentrados de compuesto activo a la superficie de los portadores, tales como arena, caolinitas o material inerte granulado, por medio de adhesivos, por ejemplo, poli(alcohol vinílico), poli(acrilato de sodio) o bien aceites minerales. Los compuestos activos adecuados también pueden granularse del modo habitual para la producción de gránulos fertilizantes - si se desea como mezcla con

55

fertilizantes.

Los gránulos dispersables en agua se producen generalmente mediante los procedimientos habituales tales como aspersión, granulación en lecho fluido, granulación en sartén, mezclado con mezcladoras de alta velocidad y extrusión sin material inerte sólido.

5 Para la producción de gránulos en sartén, en lecho fluidizado, en extrusor y por aspersión, véase los procedimientos descritos, por ejemplo, en "Spray-Drying Handbook" 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57.

10 Para obtener detalles adicionales respecto de la formulación de composiciones para la protección de cultivos véase, por ejemplo, G. C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, páginas 81-96 and J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

15 Las preparaciones agroquímicas contienen generalmente 0,1 a 99% en peso, especialmente 0,1 a 95% en peso, de los compuestos de acuerdo con la invención. En los polvos humectables, la concentración de compuesto activo es, por ejemplo, alrededor del 10% hasta el 90% en peso, el resto hasta el 100% en peso consiste en constituyentes de formulación habituales. En los concentrados emulsionables, la concentración de principio activo puede ser de alrededor del 1% al 90% y preferentemente del 5% al 80% en peso. Las formulaciones del tipo volátil contienen 1% a 30% en peso de principio activo, preferentemente usualmente 5% a 20% en peso de principio activo; las soluciones espolvoreables contienen alrededor del 0,05% al 80% en peso, preferentemente 2% al 50% en peso de principio activo. En el caso de los gránulos dispersables en agua, el contenido de compuesto activo depende parcialmente de si el compuesto activo está en forma de líquido o de sólido y de qué auxiliares de granulación, rellenos, etc., se usan. En los gránulos dispersables en agua, el contenido de compuesto activo es, por ejemplo, entre 1% y 95% en peso, preferentemente entre 10% y 80% en peso.

25 Además, las formulaciones de compuesto activo mencionadas opcionalmente comprenden los respectivos adhesivos, humectantes, dispersantes, penetrantes, conservantes, agentes anti congelamiento y disolventes habituales, rellenos, portadores y colorantes, eliminadores de espuma, inhibidores de evaporación y agentes que influyen en el pH y en la viscosidad.

30 Para la aplicación, las formulaciones en la forma comercial, si corresponden, están diluidas opcionalmente de un modo habitual, por ejemplo, en el caso de los polvos humectables, los concentrados emulsionables, las dispersiones y los gránulos dispersables en agua, con agua. Las preparaciones del tipo volátil, los gránulos para aplicación al suelo o los gránulos para dispersión y las soluciones susceptibles de asperjarse normalmente no se diluyen de manera adicional con otras sustancias inertes previo a la aplicación.

35 La tasa de aplicación requerida de los compuestos de la fórmula (I) varía con las condiciones externas, incluso, entre otras, la temperatura, la humedad y el tipo de herbicida usado. Puede variar dentro de límites amplios, por ejemplo entre 0,001 y 1,0 kg/ha o más de sustancia activa, pero es preferentemente entre 0,005 y 750 g/ha.

Los ejemplos que siguen ilustran la invención.

#### A. Ejemplos químicos

40 1. Síntesis de 1-[[2-metil-3-(metilsulfonil)-4-(trifluorometil)benzoil](5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)amino]etil carbonato de etilo (Tabla, ejemplo n.º 1-145), 1-[5-metil-2-[[2-metil-3-(metilsulfonil)-4-(trifluorometil)benzoil]imino]-1,3,4-oxadiazol-3(2H)-il]etil carbonato de etilo (Tabla, ejemplo n.º 4-145) y 1-[(etoxicarbonil)oxi]etil-2-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metilsulfonil)-4-(trifluorometil)bencencarboximidato (Tabla, ejemplo n.º 7-145): A una solución de 1,00 g (2.752 mmol) de 2-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metilsulfonil)-4-(trifluorometil)benzamida en 20 ml de acetonitrilo se agregan a temperatura ambiente 882 mg (5,78 mmol) de carbonato de 1-cloroetil etilo y 799 mg (5,78 mmol) de carbonato de potasio y la mezcla se hierve a reflujo durante 9 h. La mezcla de la reacción se concentra y luego se disuelve en 20 ml de acetato de etilo y se agregan y se extraen 20 ml de agua. La fase acuosa se extrae dos veces más con 20 ml de acetato de etilo cada vez. Las fases orgánicas combinadas se lavan con solución saturada de NaCl, se secan y se concentran. El residuo se purifica mediante RP-HPLC (acetonitrilo/agua).

50 Compuesto n.º 1-145  
Rendimiento: 170 mg (12%).  
RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.73 ppm (d, 1H); 7.53 ppm (d, 1H), 7.05-6.92 (ancho, 1H), 4.32-4.26 (m, 2H); 3.21 (s, 3H); 2.80 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.62 (d, 3H), 1.36 (t, 3H).

55 Compuesto n.º 4-145  
Rendimiento: 180 mg (12,3%).  
RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 8.04 ppm (d, 1H); 7.81 ppm (d, 1H), 6.74 (q, 1H), 4.25-4.18 (m, 2H); 3.25 (s, 3H); 2.92 (s, 3H); 2.49 (s, 3H); 1.77 (d, 3H), 1.30 (t, 3H).

Compuesto n.º 7-145

Rendimiento: 110 mg (7,9%).

RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.80 ppm (d, 1H); 7.54 ppm (d, 1H), 7.16 (q, 1H), 4.27 (q, 2H); 3.24 (s, 3H); 2.73 (s, 3H); 2.40 (s, 3H); 1.73 (d, 3H), 1.34 (t; 3H).

5 2. Síntesis de 1-[[2-cloro-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzoil](5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)amino]etil carbonato de etilo (Tabla, ejemplo n.º 1-385), 1-[5-metil-2-[[2-cloro-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzoil]imino]-1,3,4-oxadiazol-3(2H)-il]etil carbonato de etilo (Tabla, ejemplo n.º 4-385) y 1-[(etoxicarbonil)oxi]etil-2-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzencarboximidato (Tabla, ejemplo n.º 7-385):

10 De manera análoga al procedimiento de preparación mencionado con anterioridad, mediante la reacción de 1,00 g (2,719 mmol) de 2-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzamida con 871 mg (5,71 mmol) de etil carbonato de 1-cloroetilo, se aislaron:

Compuesto n.º 1-385

Rendimiento: 210 mg (13%).

15 RMN de <sup>1</sup>H(400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.70 ppm (d, 1H); 7.63 ppm (d, 1H), 7.12-6.91 (ancho, 1H), 4.28 (q, 2H); 3.07 and 3.05 (2s, 3H); 2.46 (s, 3H); 1.66 and 1.64 (2d, 3H); 1.34 (t; 3H).

Compuesto n.º 4-385

Rendimiento: 200 mg (13,7%).

20 RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.96 ppm (d, 1H); 7.74 ppm (d, 1H), 6.74 (q, 1H), 4.26-4.18 (m, 2H); 3.13 (s, 3H); 2.49 (s, 3H); 1.77 (d, 3H), 1.30 (t; 3H).

Compuesto n.º 7-385

Rendimiento: 130 mg (9,4%).

25 RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.78-7.75 ppm (2d, 1H); 7.66-7.62 ppm (2d, 1H), 7.18 (2q, 1H), 4.31-4.24 (2q, 2H); 3.08 (s, 3H); 2.42 (s, 3H); 1.74 (2d, 3H), 1.34 (2t; 3H).

3. Síntesis de 1-[[2-cloro-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzoil](5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)amino]ciclohexilcarbonato de etilo (Tabla, ejemplo n.º 3-385), 1-[2-[[2-cloro-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzoil]imino]-metil-5-1,3,4-oxadiazol-3(2H)-il]etil ciclohexil carbonato de etilo (Tabla, ejemplo n.º 6-385) y 1-[(ciclohexiloxi)carbonil]oxi]etil-2-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzencarboximidato (Tabla, ejemplo n.º 9-385):

30 De manera análoga al procedimiento de preparación mencionado con anterioridad, mediante la reacción de 1,00 g (2,719 mmol) de 2-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metilsulfinil)-4-(trifluorometil)benzamida con 1180 mg (5,71 mmol) de c carbonato de 1-cloroetilo, se aislaron:

Compuesto n.º 3-385

Rendimiento: 190 mg (10%).

35 RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.74 ppm (d, 1H); 7.65 ppm (d, 1H), 7.21-6.89 (ancho, 1H), 4.71-4.66 (m, 1H); 3.05 and 3.07 (2s, 3H); 2.48 (s, 3H), 2.00-1.88 (m, 2H), 1.80-1.71 (m, 2H), 1.70-1.20 (m, 9H).

Compuesto n.º 6-385

Rendimiento: 50 mg (3,3%).

40 RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.96 ppm (d, 1H); 7.74 ppm (d, 1H), 6.74 (q, 1H), 4.64-4.59 (m, 1H); 3.13 (s, 3H); 1.93-1.20 (m, 13H).

Compuesto n.º 9-385

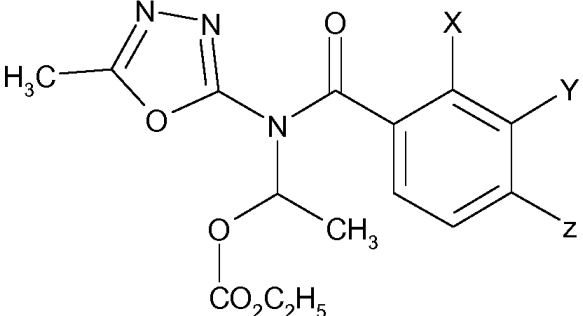
Rendimiento: 180 mg (12%).

45 RMN de <sup>1</sup>H (400 MHz; CDCl<sub>3</sub>): 7.78-7.75 ppm (2d, 1H); 7.65-7.62 ppm (2d, 1H), 7.18 (2q, 1H), 4.70-4.66 (m, 1H); 3.08 (s, 3H); 2.42 (s, 3H); 1.94-1.92 (m, 2H), 1.78-1.73 (m, 5H), 1.59-1.26 (m, 6H).

Los ejemplos mencionados en las tablas que siguen se prepararon de manera análoga a los procedimientos mencionados con anterioridad o se obtienen de manera análoga a los procedimientos mencionados con anterioridad. Los compuestos enumerados en las tablas que siguen se prefieren muy particularmente.

ES 2 747 753 T3

Tabla 1: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A1, R<sub>6</sub> es metilo, R es CH(Me) OCO<sub>2</sub>Et, W es CY y V es hidrógeno

				
N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-1	F	H	Cl	
1-2	F	H	SO <sub>2</sub> Me	
1-3	F	H	SO <sub>2</sub> Et	
1-4	F	H	CF <sub>3</sub>	
1-5	F	H	NO <sub>2</sub>	
1-6	Cl	H	Br	
1-7	Cl	H	SMe	
1-8	Cl	H	SOMe	
1-9	Cl	H	SO <sub>2</sub> Me	
1-10	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	
1-11	Cl	H	SEt	
1-12	Cl	H	SO <sub>2</sub> Et	
1-13	Cl	H	CF <sub>3</sub>	
1-14	Cl	H	NO <sub>2</sub>	
1-15	Cl	H	pirazol-1-ilo	
1-16	Cl	H	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-17	Br	H	Cl	
1-18	Br	H	Br	
1-19	Br	H	SO <sub>2</sub> Me	
1-20	Br	H	SO <sub>2</sub> Et	
1-21	Br	H	CF <sub>3</sub>	
1-22	SO <sub>2</sub> Me	H	Cl	
1-23	SO <sub>2</sub> Me	H	Br	
1-24	SO <sub>2</sub> Me	H	SMe	
1-25	SO <sub>2</sub> Me	H	SOMe	
1-26	SO <sub>2</sub> Me	H	SO <sub>2</sub> Me	
1-27	SO <sub>2</sub> Me	H	SO <sub>2</sub> Et	
1-28	SO <sub>2</sub> Me	H	CF <sub>3</sub>	
1-29	SO <sub>2</sub> Et	H	Cl	
1-30	SO <sub>2</sub> Et	H	Br	
1-31	SO <sub>2</sub> Et	H	SMe	
1-32	SO <sub>2</sub> Et	H	SOMe	
1-33	SO <sub>2</sub> Et	H	SO <sub>2</sub> Me	
1-34	SO <sub>2</sub> Et	H	CF <sub>3</sub>	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de $^1\text{H}$ (400 MHz; $\text{CDCl}_3$ ):
1-35	$\text{NO}_2$	H	F	
1-36	$\text{NO}_2$	H	Cl	
1-37	$\text{NO}_2$	H	Br	
1-38	$\text{NO}_2$	H	I	
1-39	$\text{NO}_2$	H	CN	
1-40	$\text{NO}_2$	H	$\text{SO}_2\text{Me}$	
1-41	$\text{NO}_2$	H	$\text{SO}_2\text{Et}$	
1-42	$\text{NO}_2$	H	$\text{CF}_3$	
1-43	Me	H	Cl	
1-44	Me	H	Br	
1-45	Me	H	SMe	
1-46	Me	H	$\text{SO}_2\text{Me}$	
1-47	Me	H	$\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	
1-48	Me	H	SEt	
1-49	Me	H	$\text{SO}_2\text{Et}$	
1-50	Me	H	$\text{CF}_3$	
1-51	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	H	$\text{CF}_3$	
1-52	Et	H	Cl	
1-53	Et	H	Br	
1-54	Et	H	SMe	
1-55	Et	H	$\text{SO}_2\text{Me}$	
1-56	Et	H	$\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	
1-57	Et	H	SEt	
1-58	Et	H	$\text{SO}_2\text{Et}$	
1-59	Et	H	$\text{CF}_3$	
1-60	$\text{CF}_3$	H	Cl	
1-61	$\text{CF}_3$	H	Br	
1-62	$\text{CF}_3$	H	$\text{SO}_2\text{Me}$	
1-63	$\text{CF}_3$	H	$\text{SO}_2\text{Et}$	
1-64	$\text{CF}_3$	H	$\text{CF}_3$	
1-65	$\text{NO}_2$	$\text{NH}_2$	F	
1-66	$\text{NO}_2$	NHMe	F	
1-67	$\text{NO}_2$	$\text{NMe}_2$	F	
1-68	$\text{NO}_2$	Me	Cl	
1-69	$\text{NO}_2$	$\text{NH}_2$	Cl	
1-70	$\text{NO}_2$	NHMe	Cl	
1-71	$\text{NO}_2$	$\text{NMe}_2$	Cl	
1-72	$\text{NO}_2$	$\text{NH}_2$	Br	
1-73	$\text{NO}_2$	NHMe	Br	
1-74	$\text{NO}_2$	$\text{NMe}_2$	Br	
1-75	$\text{NO}_2$	$\text{NH}_2$	$\text{CF}_3$	
1-76	$\text{NO}_2$	$\text{NMe}_2$	$\text{CF}_3$	
1-77	$\text{NO}_2$	$\text{NH}_2$	$\text{SO}_2\text{Me}$	
1-78	$\text{NO}_2$	$\text{NH}_2$	$\text{SO}_2\text{Et}$	
1-79	$\text{NO}_2$	NHMe	$\text{SO}_2\text{Me}$	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-80	NO <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-81	NO <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Et	
1-82	NO <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-83	NO <sub>2</sub>	NHMe	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-84	NO <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	
1-85	Me	SMe	H	
1-86	Me	SOMe	H	
1-87	Me	SO <sub>2</sub> Me	H	
1-88	Me	SEt	H	
1-89	Me	SOEt	H	
1-90	Me	SO <sub>2</sub> Et	H	
1-91	Me	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	
1-92	Me	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	
1-93	Me	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	
1-94	Me	F	F	
1-95	Me	F	Cl	
1-96	Me	SEt	F	
1-97	Me	SOEt	F	
1-98	Me	SO <sub>2</sub> Et	F	
1-99	Me	Me	Cl	
1-100	Me	F	Cl	
1-101	Me	Cl	Cl	
1-102	Me	NH <sub>2</sub>	Cl	
1-103	Me	NHMe	Cl	
1-104	Me	NMe <sub>2</sub>	Cl	
1-105	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-106	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	Cl	
1-107	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	Cl	
1-108	Me	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	Cl	
1-109	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO-NMe <sub>2</sub>	Cl	
1-110	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NH(CO)NMe <sub>2</sub>	Cl	
1-111	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NH(CO)NHCO <sub>2</sub> Et	Cl	
1-112	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NHCO <sub>2</sub> Me	Cl	
1-113	Me	OCH <sub>2</sub> -NHCO <sub>2</sub> cPr	Cl	
1-114	Me	O(CH <sub>2</sub> )-5-2,4-dimetil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	Cl	
1-115	Me	O(CH <sub>2</sub> )-3,5-dimetil-1,2-oxazol-4-ilo	Cl	
1-116	Me	SMe	Cl	
1-117	Me	SOMe	Cl	
1-118	Me	SO <sub>2</sub> Me	Cl	
1-119	Me	SEt	Cl	
1-120	Me	SOEt	Cl	
1-121	Me	SO <sub>2</sub> Et	Cl	
1-122	Me	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-123	Me	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-124	Me	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-125	Me	NH <sub>2</sub>	Br	
1-126	Me	NHMe	Br	
1-127	Me	NMe <sub>2</sub>	Br	
1-128	Me	OCH <sub>2</sub> (CO)NMe <sub>2</sub>	Br	
1-129	Me	O(CH <sub>2</sub> )-5-pirrolidin-2-ona	Br	
1-130	Me	SMe	Br	
1-131	Me	SOMe	Br	
1-132	Me	SO <sub>2</sub> Me	Br	
1-133	Me	SEt	Br	
1-134	Me	SOEt	Br	
1-135	Me	SO <sub>2</sub> Et	Br	
1-136	Me	SMe	I	
1-137	Me	SOMe	I	
1-138	Me	SO <sub>2</sub> Me	I	
1-139	Me	SEt	I	
1-140	Me	SOEt	I	
1-141	Me	SO <sub>2</sub> Et	I	
1-142	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	
1-143	Me	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-144	Me	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-145	Me	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	7,73 ppm (d, 1H); 7,53 ppm (d, 1H), 7,05-6,92 (ancho, 1H), 4,32 -4,26 (m, 2H); 3,21 (s, 3H); 2,80 (s, 3H), 2,43 (s, 3H), 1,62 (d, 3H), 1,36 (t, 3H)
1-146	Me	SEt	CF <sub>3</sub>	
1-147	Me	SOEt	CF <sub>3</sub>	
1-148	Me	SO <sub>2</sub> Et	CF <sub>3</sub>	
1-149	Me	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-150	Me	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-151	Me	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-152	Me	Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-153	Me	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-154	Me	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-155	Me	5-cianometil- 4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-156	Me	5-cianometil- 4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-157	Me	NH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-158	Me	NHMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-159	Me	NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-160	Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-161	Me	pirazol-1-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-162	Me	OH	SO <sub>2</sub> Me	
1-163	Me	OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-164	Me	OMe	SO <sub>2</sub> Et	

ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-165	Me	OEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-166	Me	OEt	SO <sub>2</sub> Et	
1-167	Me	OiPr	SO <sub>2</sub> Me	
1-168	Me	OiPr	SO <sub>2</sub> Et	
1-169	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-170	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-171	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-172	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-173	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-174	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-175	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHSO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-176	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHSO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Et	
1-177	Me	OCH <sub>2</sub> (CO)NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-178	Me	OCH <sub>2</sub> (CO)NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Et	
1-179	Me	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-180	Me	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-181	Me	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O(3,5-dimetoxipirimidin-2-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-182	Me	Cl	SO <sub>2</sub> Me	
1-183	Me	SMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-184	Me	SOMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-185	Me	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-186	Me	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Et	
1-187	Me	SEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-188	Me	SOEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-189	Me	SO <sub>2</sub> Et	SO <sub>2</sub> Me	
1-190	Me	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-191	Me	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-192	Me	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-193	CH <sub>2</sub> SMe	OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-194	CH <sub>2</sub> OMe	OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-195	CH <sub>2</sub> O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-196	CH <sub>2</sub> O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-197	CH <sub>2</sub> O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-198	CH <sub>2</sub> O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-199	CH <sub>2</sub> O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-200	Et	SMe	Cl	
1-201	Et	SO <sub>2</sub> Me	Cl	
1-202	Et	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-203	Et	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-204	Et	F	SO <sub>2</sub> Me	
1-205	Et	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-206	iPr	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	



## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-207	cPr	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-208	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	F	
1-209	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	F	
1-210	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	F	
1-211	CF <sub>3</sub>	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	F	
1-212	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-213	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	Cl	
1-214	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	Cl	
1-215	CF <sub>3</sub>	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	Cl	
1-216	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Br	
1-217	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	Br	
1-218	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	Br	
1-219	CF <sub>3</sub>	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	Br	
1-220	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	I	
1-221	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	I	
1-222	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	I	
1-223	CF <sub>3</sub>	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	I	
1-224	CF <sub>3</sub>	F	SO <sub>2</sub> Me	
1-225	CF <sub>3</sub>	F	SO <sub>2</sub> Et	
1-226	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-227	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-228	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-229	CF <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-230	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-231	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Et	
1-232	CF <sub>3</sub>	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-233	CF <sub>3</sub>	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-234	F	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-235	F	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-236	Cl	Me	Cl	
1-237	Cl	OCH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	Cl	
1-238	Cl	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Cl	
1-239	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-240	Cl	OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub>	Cl	
1-241	Cl	O(CH <sub>2</sub> )-5-pirrolidin-2-ona	Cl	
1-242	Cl	SMe	Cl	
1-243	Cl	SOMe	Cl	
1-244	Cl	SO <sub>2</sub> Me	Cl	
1-245	Cl	F	SMe	
1-246	Cl	Cl	SO <sub>2</sub> Me	
1-247	Cl	CO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-248	Cl	CONMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-249	Cl	CONMe(OMe)	SO <sub>2</sub> Me	
1-250	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-251	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-252	Cl	CH <sub>2</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-253	Cl	CH <sub>2</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Et	
1-254	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-255	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-256	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	
1-257	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-258	Cl	CH <sub>2</sub> OcPentilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-259	Cl	CH <sub>2</sub> PO(OMe) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-260	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3ilo	SMe	
1-261	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-262	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-3ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-263	Cl	5-cianometil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-264	Cl	5-cianometil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-265	Cl	5-(Metoximetil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3 ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-266	Cl	5-(Metoximetil)-5-Metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3 ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-267	Cl	CH <sub>2</sub> O-tetrahidrofuran-3-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-268	Cl	CH <sub>2</sub> O-tetra-hidrofuran-3-ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-269	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -tetrahidrofuran-2-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-270	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -tetra-hidrofuran-2-ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-271	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -tetra-hidrofuran-3-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-272	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -tetra-hidrofuran-3-ilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-273	Cl	OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-274	Cl	OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-275	Cl	OEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-276	Cl	OEt	SO <sub>2</sub> Et	
1-277	Cl	OiPr	SO <sub>2</sub> Me	
1-278	Cl	OiPr	SO <sub>2</sub> Et	
1-279	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-280	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-281	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-282	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-283	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-284	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-285	Cl	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-286	Cl	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-287	Cl	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-288	Cl	OCH <sub>2</sub> (CO)NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	
1-289	Cl	OCH <sub>2</sub> (CO)NMe <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Et	
1-290	Cl	SMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-291	Cl	SOMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-292	Br	OMe	Br	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-293	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Br	
1-294	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-295	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-296	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-297	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-298	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-299	Br	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-300	Br	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-301	Br	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-302	I	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-303	I	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-304	I	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-305	I	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-306	I	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-307	I	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	
1-308	I	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-309	I	[1,4]dioxan-2-il-metoxilo	SO <sub>2</sub> Et	
1-310	OMe	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-311	OMe	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-312	OMe	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-313	OMe	SOEt	CF <sub>3</sub>	
1-314	OMe	SO <sub>2</sub> Et	CF <sub>3</sub>	
1-315	OMe	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-316	OMe	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-317	OMe	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-318	OMe	SMe	Cl	
1-319	OMe	SOMe	Cl	
1-320	OMe	SO <sub>2</sub> Me	Cl	
1-321	OMe	SEt	Cl	
1-322	OMe	SOEt	Cl	
1-323	OMe	SO <sub>2</sub> Et	Cl	
1-324	OMe	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-325	OMe	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-326	OMe	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-327	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-328	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-329	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-330	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SEt	CF <sub>3</sub>	
1-331	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SOEt	CF <sub>3</sub>	
1-332	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> Et	CF <sub>3</sub>	
1-333	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-334	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-335	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	
1-336	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SMe	Cl	
1-337	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SOMe	Cl	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-338	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> Me	Cl	
1-339	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SEt	Cl	
1-340	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SOEt	Cl	
1-341	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> Et	Cl	
1-342	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-343	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-344	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	
1-345	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-346	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SOMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-347	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-348	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-349	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SOEt	SO <sub>2</sub> Me	
1-350	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> Et	SO <sub>2</sub> Me	
1-351	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-352	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-353	OCH <sub>2</sub> -c-Pr	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-354	SO <sub>2</sub> Me	F	CF <sub>3</sub>	
1-355	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	
1-356	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	Cl	
1-357	SMe	SEt	F	
1-358	SMe	SMe	F	
1-359	SMe	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-360	SMe	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-361	SMe	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-362	SMe	SMe	Cl	
1-363	SMe	SMe	Br	
1-364	Cl	Ac	CF <sub>3</sub>	
1-365	Cl	Ac	SO <sub>2</sub> Me	
1-366	Cl	C(O)cPr	CF <sub>3</sub>	
1-367	Cl	C(O)cPr	SO <sub>2</sub> Me	
1-368	Cl	CH <sub>2</sub> SMe	CF <sub>3</sub>	
1-369	Cl	CH <sub>2</sub> S(O)Me	CF <sub>3</sub>	
1-370	Cl	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-371	Cl	CH <sub>2</sub> SMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-372	Cl	CH <sub>2</sub> S(O)Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-373	Cl	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-374	Cl	CH=NOMe	CF <sub>3</sub>	
1-375	Cl	CH=NOMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-376	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-377	Cl	4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-378	Cl	3-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-379	Cl	3-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-380	Cl	vinilo	CF <sub>3</sub>	
1-381	Cl	vinilo	SO <sub>2</sub> Me	

## ES 2 747 753 T3

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-382	Cl	CO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-383	Cl	CO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-384	Cl	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-385	Cl	S(O)Me	CF <sub>3</sub>	7,70 ppm (d, 1H); 7,63 ppm (d, 1H), 7,12-6,91 (ancho, 1H), 4,28 (q, 2H); 3,07 y 3,05 (2s, 3H); 2,46 (s, 3H), 1,66 y 1,64 (2d, 3H), 1,34 (t, 3H)
1-386	Cl	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-387	Cl	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-388	Cl	SMe	Me	
1-389	Cl	SOMe	Me	
1-390	Cl	SO <sub>2</sub> Me	Me	
1-391	Cl	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-392	Cl	1H-1,2,3-triazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-393	Cl	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-394	Cl	1H-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-395	Cl	1H-4-cloropirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-396	Cl	1H-3-bromo-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-397	Cl	1H-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-398	Cl	pirrolidin-2-on-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-399	Cl	morfolin-3-on-4-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-400	Cl	1,2-tiazolidin-1,1-dioxid-2-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-401	Br	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-402	Br	1H-1,2,3-triazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-403	Br	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-404	Br	1H-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-405	Br	1H-4-cloropirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-406	Br	1H-3-bromo-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-407	Br	1H-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-408	Br	pirrolidin-2-on-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-409	Br	morfolin-3-on-4-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-410	Br	1,2-tiazolidin-1,1-dioxid-2-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-411	CH <sub>2</sub> OMe	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-412	CH <sub>2</sub> OMe	1H-1,2,3-triazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-413	CH <sub>2</sub> OMe	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-414	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CF <sub>3</sub>	
1-415	CF <sub>3</sub>	OMe	CF <sub>3</sub>	
1-416	CF <sub>3</sub>	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-417	CF <sub>3</sub>	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-418	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-419	CF <sub>3</sub>	1H-pirazol-1-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-420	Me	SMe	Et	
1-421	Me	SOMe	Et	
1-422	Me	SO <sub>2</sub> Me	Et	
1-423	Me	1H-pirazol-1-ilo	Et	

(continuación)

N.º	X	Y	Z	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H (400 MHz; CDCl <sub>3</sub> ):
1-424	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Et	
1-425	Me	OMe	Et	
1-426	Me	Ac	CF <sub>3</sub>	
1-427	Me	Ac	SO <sub>2</sub> Me	
1-428	Me	C(O)cPr	CF <sub>3</sub>	
1-429	Me	C(O)cPr	SO <sub>2</sub> Me	
1-430	Me	CH <sub>2</sub> SMe	CF <sub>3</sub>	
1-431	Me	CH <sub>2</sub> S(O)Me	CF <sub>3</sub>	
1-432	Me	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-433	Me	CH <sub>2</sub> SMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-434	Me	CH <sub>2</sub> S(O)Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-435	Me	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-436	Me	CH=NOMe	CF <sub>3</sub>	
1-437	Me	CH=NOMe	SO <sub>2</sub> Me	
1-438	Me	4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo,	CF <sub>3</sub>	
1-439	Me	4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-440	Me	3-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	CF <sub>3</sub>	
1-441	Me	3-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-442	Me	vinilo	CF <sub>3</sub>	
1-443	Me	vinilo	SO <sub>2</sub> Me	
1-444	Me	CO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-445	Me	CO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	
1-446	Cl	SMe	CF <sub>3</sub>	
1-447	Cl	SOMe	CF <sub>3</sub>	
1-448	Cl	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	
1-449	Et	SEt	CF <sub>3</sub>	
1-450	Et	SOEt	CF <sub>3</sub>	
1-451	Et	SO <sub>2</sub> Et	CF <sub>3</sub>	

Tabla 2: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A1, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>Me, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 2 contiene 451 compuestos (2-1 a 2-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.

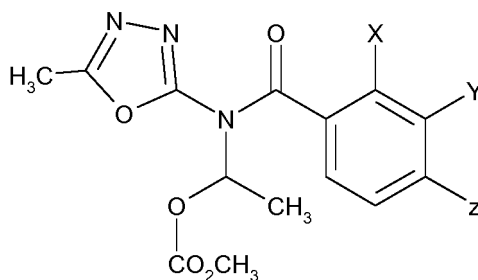
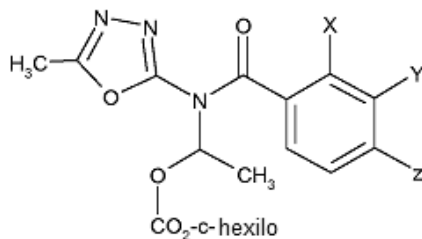
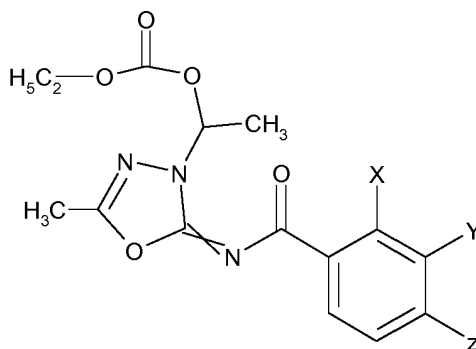


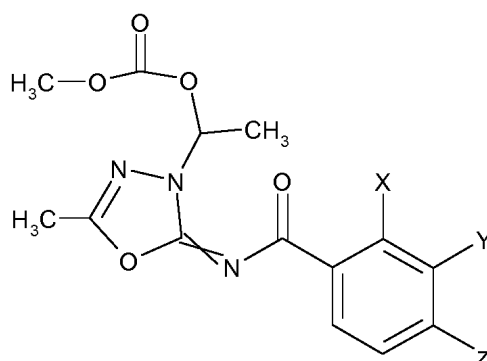
Tabla 3: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A1, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>-c-hexilo, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 3 contiene 451 compuestos (3-1 a 3-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.



5 Tabla 4: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A2, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>Et, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 4 contiene 451 compuestos (4-1 a 4-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.



10 Tabla 5: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A2, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>Me, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 5 contiene 451 compuestos (5-1 a 5-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.



15 Tabla 6: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A2, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>-c-hexilo, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 6 contiene 451 compuestos (6-1 a 6-451) en los que X, Y y Z tienen los significados como tal como se define en la Tabla 1.

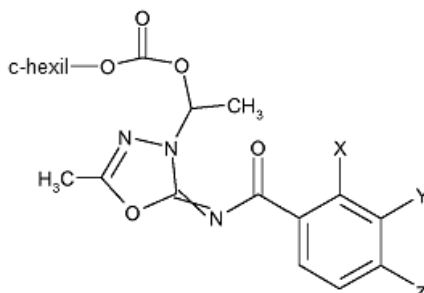
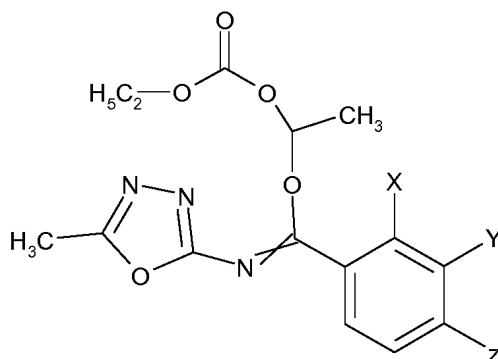
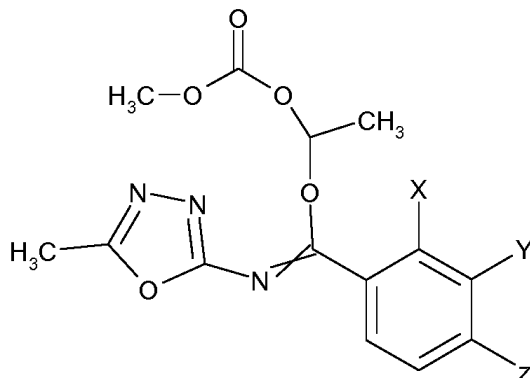


Tabla 7: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A3, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>Et, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 7 contiene 451 compuestos (7-1 a 7-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.



5 Tabla 8: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A3, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>Me, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 8 contiene 451 compuestos (8-1 a 8-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.



10 Tabla 9: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A3, R<sup>6</sup> es metilo, R es CH(Me)OCO<sub>2</sub>-c-hexilo, W es CY y V es hidrógeno. La Tabla 9 contiene 451 compuestos (9-1 a 9-451) en los que X, Y y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 1.

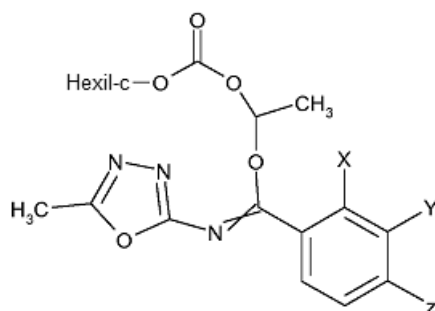




Tabla 10: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A1, W es N, R<sub>6</sub> es metilo y V es hidrógeno, y R, X y Z tienen los significados indicados en la Tabla 10.

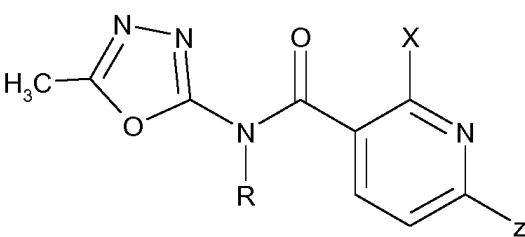
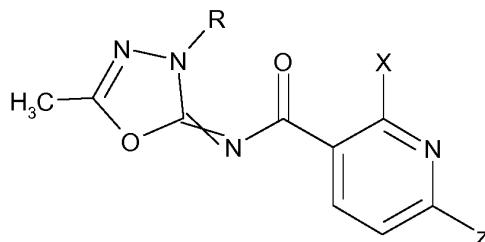
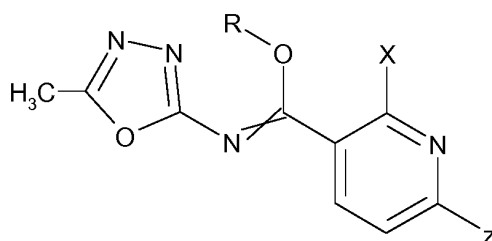
				
N.º	X	Z	R	Datos físicos (RMN de <sup>1</sup> H, DMSO-d <sub>6</sub> , 400 MHz)
10-1	Cl	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Et	
10-2	Cl	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Me	
10-3	Cl	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> -c- hexilo	
10-4	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Et	
10-5	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Me	
10-6	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> -c-hexilo	
10-7	Br	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Et	
10-8	Br	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Me	
10-9	Br	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> -c- hexilo	
10-10	Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Et	
10-11	Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Me	
10-12	Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> -c-hexilo	
10-13	Me	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Et	
10-14	Me	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Me	
10-15	Me	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> -c- hexilo	
10-16	Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Et	
10-17	Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Me	
10-18	Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> -c-hexilo	
10-19	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Et	
10-20	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Me	
10-21	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> -c- hexilo	
10-22	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Et	
10-23	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Me	
10-24	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> -c-hexilo	
10-25	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Et	
10-26	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> Me	
10-27	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH(Me) OCO <sub>2</sub> -c- hexilo	
10-28	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Et	
10-29	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> Me	
10-30	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCO <sub>2</sub> -c-hexilo	

Tabla 11: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A2, W es N, R<sup>6</sup> es metilo y V es hidrógeno. La Tabla 11 contiene 30 compuestos (11-1 a 11-30) en los que R, X y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 10.



5 Tabla 12: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I), en la que A es A3, W es N, R<sup>6</sup> es metilo y V es hidrógeno. La Tabla 12 contiene 30 compuestos (12-1 a 12-30) en los que R, X y Z tienen los significados tal como se define en la Tabla 10.



Las abreviaturas usadas significan:

Et	= etilo	Me	= metilo	n-Pr	= n-propilo	i-Pr	= isopropilo
c-Pr	= ciclopropilo	Ph	= fenilo	Bn	= bencilo	Bu	= butilo
c	= ciclo						

10

### B. Ejemplos de formulación

a) Un producto volátil se obtiene mediante el mezclado de 10 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y desmenuzando la mezcla con un molino de martillo.

15

b) Un polvo humectable que es ampliamente dispersable en agua se obtiene mediante el mezclado de 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I), 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de lignosulfonato de potasio y 1 parte en peso de oleoilmetilaurato de sodio como agente humectante y dispersante, y moliendo la mezcla en un molino de disco sujetado.

20

c) Un concentrado de dispersión dispersable en agua se obtiene mediante la mezcla de 20 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) con 6 partes en peso de alquilfenol poliglicol éter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanol poliglicol éter (8 OE) y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico (rango de ebullición por ejemplo de alrededor de 255 hasta por encima de 277°C) y moliendo la mezcla en un molino de bola hasta lograr una finura inferior a los 5 micrones.

25

d) Un concentrado emulsionable se obtiene a partir de 15 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I), 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxiethylado como emulsionante.

30

e) Los gránulos dispersables en agua se obtienen mediante el mezclado de  
 75 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I),  
 10 partes en peso de lignosulfonato de calcio,  
 5 partes en peso de lauril sulfato de sodio,  
 3 partes en peso de poli(alcohol vinílico) y,  
 7 partes en peso de caolín,

moliendo la mezcla en un molino de disco sujetado, y granulando el polvo en un lecho fluidizado mediante aplicación con aerosol de agua como líquido de granulación.

35

f) los gránulos dispersables en agua también se obtienen mediante la homogenización y pre-desmenuzamiento, en un molino coloide, de

- 5 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I),  
 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,

luego se muele la mezcla en un molino de perlas y se atomiza y se seca la suspensión resultante en una torre de aspersión por medio de una boquilla de una fase.

**C. Ejemplos biológicos**

10 1. Acción herbicida previa a la emergencia contra plantas dañinas

15 Semillas de malezas monocotiledóneas y dicotiledóneas o plantas de cultivo se disponen en macetas de fibra de madera en tierra arenosa y se cubren con tierra. Los compuestos de acuerdo con la invención, formulados en la forma de polvos humectables (WP) o como concentrados en emulsión (EC), se aplican entonces a la superficie de la tierra que la cubre en la forma de suspensión o emulsión acuosa, a un índice de aplicación de agua que equivale a  
 600 a 800 l/ha con la incorporación de 0,2% de agente humectante. Después del tratamiento, las macetas se colocan en un invernadero y se mantienen en buenas condiciones de crecimiento para las plantas experimentales. El daño a las plantas experimentales se califica visualmente después de un período de análisis de 3 semanas mediante comparación con los controles sin tratar (actividad herbicida en porcentaje (%): 100% de actividad = las plantas han muerto; 0% de actividad = como plantas de control). Aquí, por ejemplo, los compuestos n.º 1-145, 1-385, 3-385, 4-145, 4-385, 6-385, 7-145, 7-385 y 9-385, a una tasa de aplicación de 320 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos el 80% contra *Stellaria media* y *Veronica persica*.

2. Acción herbicida posterior a la emergencia contra plantas dañinas

25 Las semillas de malezas monocotiledóneas y dicotiledóneas y las plantas de cultivo se disponen en tierra arenosa en macetas de fibra de madera, cubiertas con tierra y cultivadas en invernadero en condiciones de cultivo buenas. 2 a 3 semanas después de sembrar, las plantas experimentales se tratan en la etapa de una sola hoja. Los compuestos de acuerdo con la invención, formulados en la forma de polvos humectables (WP) o como concentrados en emulsión (EC), se asperjan entonces sobre las partes verdes de las plantas en la forma de suspensión o emulsión acuosa, a un índice de aplicación de agua que equivale a 600 a 800 l/ha con la incorporación de 0,2% de agente humectante. Después de que se han dejado las plantas de análisis reposar en el invernadero en condiciones de crecimiento óptimas durante alrededor de 3 semanas, la acción de las preparaciones se analiza visualmente en comparación con los controles no tratados (acción herbicida en porcentaje (%): 100% de actividad = las plantas han muerto; 0% de actividad = como plantas de control). Aquí, por ejemplo, los compuestos n.º 1-145, 1-385, 3-385, 4-145, 4-385, 6-385, 7-145, 7-385 y 9-385, a una tasa de aplicación de 80 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos el 80% contra *Stellaria media* y *Amaranthus retroflexus*.

35 3. Experimento comparativo en la pre-emergencia

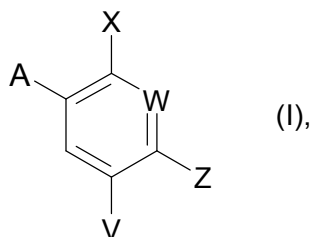
Para fines comparativos, se analizó la actividad herbicida de algunos compuestos de acuerdo con la invención y los compuestos estructuralmente más similares conocidos del estado de la técnica.

Compuesto	Dosificación [g/ha]	Actividad herbicida contra ALOMY
N.º 7-385, de acuerdo con la invención	80	90%
<i>N.º 2-360, del documento WO 2012/126932</i>	80	70%
N.º 3-385, de acuerdo con la invención	80	100%
<i>N.º 2-360, del documento WO 2012/126932</i>	80	70%
N.º 9-385, de acuerdo con la invención	80	90%
<i>N.º 2-360, del documento WO 2012/126932</i>	80	70%
N.º 1-145, de acuerdo con la invención	80	100%
<i>N.º D-001, del documento WO 2013/087577</i>	80	0%

40 Los experimentos muestran, a modo de ejemplo, la actividad herbicida superior de los compuestos de acuerdo con la invención sobre la planta dañina *Alopecurus myosuroides* (ALOMY).

## REIVINDICACIONES

1. Derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida de la fórmula (I)

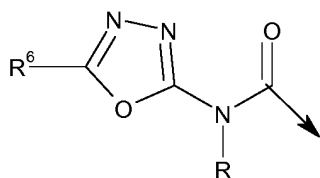


en la que los símbolos y los índices tienen los siguientes significados:

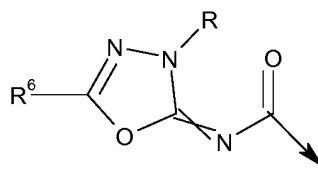
- 5 W significa N o CY,  
 X y Z significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, formilo, tiocianato, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), COR<sup>1</sup>, OR<sup>1</sup>, OCOR<sup>1</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OCOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>, P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, o heteroarilo, heterociclilo o fenilo sustituidos en cada caso con s restos del grupo de metilo, etilo, metoxilo, nitro, trifluorometilo y halógeno,  
 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquenilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), COR<sup>1</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, OCO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, OC(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C(O)N(R<sup>1</sup>)OR<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, OR<sup>1</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OCOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OSO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-N=C(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-fenilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en donde los 6 restos mencionados en último lugar están sustituidos cada uno de ellos con s restos del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), S(O)<sub>n</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y cianometilo, y en los que heterociclilo porta n grupos oxo, o  
 Y y Z junto con los dos átomos a los que están unidos forman un anillo de 5, 6 o 7 miembros, insaturado, parcialmente saturado o saturado que, además de átomos de carbono, comprende cada uno de ellos s átomos de nitrógeno, n átomos de oxígeno, n átomos de azufre y n elementos S(O), S(O)<sub>2</sub>, C=N-R<sup>8</sup>, C(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C[-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-] o C(O) como miembros del anillo,  
 cuyos átomos de carbono están sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenoxi, halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alquilo y fenilo,  
 cuyos átomos de nitrógeno están sustituidos en cada caso con n restos del grupo que consiste en alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y fenilo, y en los que los restos fenilo mencionados anteriormente están sustituidos en cada caso con s restos del grupo que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 V significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), OR<sup>1</sup> o S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>,  
 R<sup>1</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquenilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heterociclilo, en donde los 21 restos mencionados en último lugar están sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR<sup>3</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>, N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup>OR<sup>3</sup>, COR<sup>3</sup>, OCOR<sup>3</sup>, SCOR<sup>4</sup>, NR<sup>3</sup>COR<sup>3</sup>, NR<sup>3</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>, COSR<sup>4</sup>, CON(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub> y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-carbonilo, y en donde heterociclilo porta n grupos oxo,  
 R<sup>2</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquenilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-O-heterociclilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>3</sup>-heterociclilo, en donde los 21 restos mencionados en último lugar están sustituidos con s restos del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR<sup>3</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>, N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup>OR<sup>3</sup>, COR<sup>3</sup>, OCOR<sup>3</sup>, SCOR<sup>4</sup>, NR<sup>3</sup>COR<sup>3</sup>, NR<sup>3</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>, COSR<sup>4</sup>, CON(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub> y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-carbonilo, y en donde heterociclilo porta n grupos oxo,  
 R<sup>3</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 R<sup>4</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) o alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 R<sup>5</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
 n significa 0, 1 o 2,  
 s significa 0, 1, 2 o 3,  
 A significa un resto A1, A2 o A3

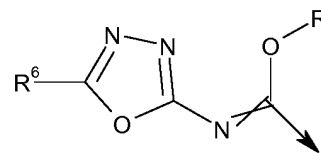
5



A1



A2



A3

R significa alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OC(O)N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub> o alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OC(O)OR<sup>10</sup>,  
 R<sup>6</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>1</sup>O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CH<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), OR<sup>1</sup>, NHR<sup>1</sup>, metoxicarbonilo,  
 etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, metilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, dimetilamino,  
 acetilamino, metilsulfenilo, metilsulfino, metilsulfonilo o heteroarilo, heterociclilo, bencilo o fenilo sustituidos cada  
 uno de ellos con s restos del grupo de halógeno, nitro, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-  
 C<sub>6</sub>), S(O)<sub>n</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
 R<sup>7</sup> significa acetoxi, acetamido, N-metilacetamido, benzoiloxi, benzamido, N-metilbenzamido, metoxicarbonilo,  
 etoxicarbonilo, benzoilo, metilcarbonilo, piperidinilcarbonilo, morfolinilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo,  
 aminocarbonilo, metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) o heteroarilo,  
 heterociclilo o fenilo en cada caso sustituidos con s restos del grupo de metilo, etilo, metoxilo, trifluorometilo y  
 halógeno,  
 R<sup>8</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 R<sup>9</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 R<sup>10</sup> significa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>).

10

15

20

2. Derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en los que R<sup>6</sup> significa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>1</sup>O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>).

25

3. Derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida de la fórmula (I) según las reivindicaciones 1 o 2, en los que W significa CY,

X y Z significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halocicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), OR<sup>1</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, o heteroarilo, heterociclilo o fenilo sustituidos en cada caso con s restos del grupo de metilo, etilo, metoxilo, nitro, trifluorometilo y halógeno,

30

Y significa hidrógeno, alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), COR<sup>1</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, OCO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>1</sup>C(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, OC(O)N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C(O)N(R<sup>1</sup>)OR<sup>1</sup>, NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, OR<sup>1</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OCOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CON(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>COR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-CH=NOR<sup>1</sup>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-heterociclilo, heteroarilo o heterociclilo, en donde los 4 restos mencionados en último lugar están sustituidos cada uno de ellos con s restos del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), S(O)<sub>n</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), halo-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y cianometilo, y en donde heterociclilo porta n grupos oxo,

35

V significa hidrógeno, Cl, OMe, metilo o etilo,  
 R<sup>6</sup> significa metilo, etilo, metoximetilo o metoxietilo.

40

4. Derivados de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 3, en los que

X significa F, Cl, Br, metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo, metoxilo, metoximetilo, metoxietoximetilo, SMe o SO<sub>2</sub>Me,

45

Z significa hidrógeno, F, Cl, Br, I, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, pentafluoroetilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo,

Y significa hidrógeno, SMe, S(O)Me, SO<sub>2</sub>Me, SEt, S(O)Et, SO<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>OEt, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>SMe, CH<sub>2</sub>S(O)Me, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me, vinilo, C(O)Me, C(O)Et, C(O)cPr, CO<sub>2</sub>Me, CHN=OMe, 4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 5- metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 5-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 5-cianometil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo, 4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo, 3-metil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-ilo, 1H-pirazol-1-ilo, 1H-1,2,3-triazol-1-ilo, 2H-1,2,3-triazol-2-ilo, 1H-1,2,4-triazol-1-ilo, pirrolidin-2-on-1-ilo, morfolin-3-on-4-ilo, OMe, OEt, OnPr, OCH<sub>2</sub>cPr, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe o OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe

50

V significa hidrógeno,

R significa CH<sub>2</sub>OCO<sub>2</sub>Et, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>Me, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>Et, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>-c-hexilo, CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>-i-Pr o CH(CH<sub>3</sub>)OCO<sub>2</sub>-t-Bu,

R<sup>6</sup> significa metilo.

5. Agente herbicida **caracterizada por** una cantidad efectiva como herbicida de al menos un derivado de N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)arilcarboxamida de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4.
6. Agente herbicida según la reivindicación 5 en mezcla con auxiliares de formulación.
- 5 7. Agente herbicida según las reivindicaciones 5 o 6 que contiene al menos una sustancia activa como plaguicida adicional del grupo de los insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores del crecimiento.
8. Agente herbicida según la reivindicación 7 que contiene un protector selectivo.
9. Agente herbicida según la reivindicación 5 que contiene ciprosumfamida, cloquintocet-mexilo, mfenpir-dietilo o isoxadifen-etilo.
- 10 10. Agente herbicida según una de las reivindicaciones 7 a 9 que contiene un herbicida adicional.
11. Procedimiento para controlar plantas indeseadas, **caracterizado porque** una cantidad efectiva de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o de un agente herbicida según una de las reivindicaciones 5 a 10 se aplica a las plantas o al sitio del crecimiento de plantas indeseado.
- 15 12. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o de agentes herbicidas según una de las reivindicaciones 5 a 10 para controlar plantas indeseadas.
13. Uso según la reivindicación 12, **caracterizado porque** los compuestos de la fórmula (I) se usan para controlar plantas indeseadas en cultivos de plantas útiles.
14. Uso como según la reivindicación 13, **caracterizado porque** las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.