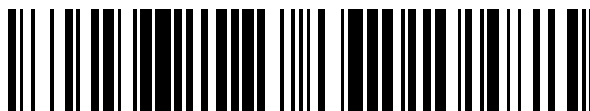


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 375 639**

51 Int. Cl.:
C07D 401/04 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
C07D 211/54 (2006.01)
C07D 211/58 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06811453 .7**
96 Fecha de presentación: **06.10.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **1947098**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **23.07.2008**

54 Título: **COMPUESTOS DE AMINAS CÍCLICAS Y AGENTE PARA EL CONTROL DE PLAGAS.**

30 Prioridad:
06.10.2005 JP 2005294126
06.10.2005 JP 2005294127
12.10.2005 JP 2005297803
12.10.2005 JP 2005297804
25.01.2006 JP 2006016877
30.06.2006 JP 2006182314

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
02.03.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
02.03.2012

73 Titular/es:
NIPPON SODA CO., LTD.
2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8165, JP

72 Inventor/es:
HAMAMOTO, Isami;
TAKAHASHI, Jun;
YANO, Makio;
KAWAGUCHI, Masahiro;
HANAI, Daisuke y
IWASA, Takao

74 Agente: **Curell Aguilá, Mireia**

ES 2 375 639 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos de aminas cíclicas y agente para el control de plagas.

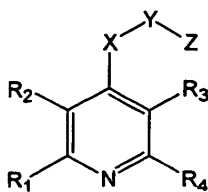
5 Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevos compuestos de aminas cíclicas y a agentes para el control de plagas que contienen estos compuestos de aminas cíclicas o similares como principios activos.

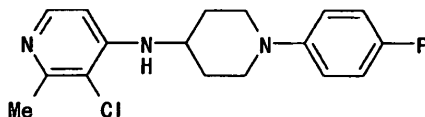
10 Descripción de la técnica relacionada

Aunque muchos compuestos que tienen actividades insecticidas/acaricidas son conocidos convencionalmente, existen problemas tales como un efecto insuficiente de los mismos, limitación del uso de los mismos debido a problemas de resistencia a las medicinas, aparición de fitotoxicidad o contaminación en el cuerpo de las plantas, o gran toxicidad con respecto a mamíferos, peces o similares.

Es conocido que los compuestos representados por la fórmula a continuación presentan actividades insecticidas/acaricidas:



En la fórmula, X representa O, S, NH, NR o NOR; Y representa un enlace (entrecruzado) o similar; Z representa cicloalquilo C3 a C8 o similar; y CH₂ en estos anillos de hidrocarburos en este caso puede ser sustituido con NR₅ (R₅ es fenilo o fenilo sustituido). Los ejemplos específicos conocidos de tales compuestos incluyen el compuesto representado por la fórmula a continuación (referirse al documento de patente 1):



Sin embargo, las estructuras de tales compuestos están limitadas a derivados de 4-aminopiridina y derivados de 4-hidroxipiridina y no se dan a conocer específicamente compuestos con otras estructuras.

Documento de patente 1: Traducción japonesa publicada N^o Hei 09-502446 de publicación internacional PCT.

El documento US-A-5.571.815 da a conocer determinadas piperidinas que pueden ser utilizadas como agentes pesticidas.

El documento US-A-5.723.450 da a conocer compuestos pesticidas a base de piridin-4-ilamino-ciclohexanos.

El documento WO-A-2004/099160 describe compuestos pesticidas a base de 1-(pirimidin-4-il)-piperidinas.

El documento WO-A-2005/036961 da a conocer compuestos pesticidas a base de 1-fenilmetil-4-difenilmetil-piperidinas.

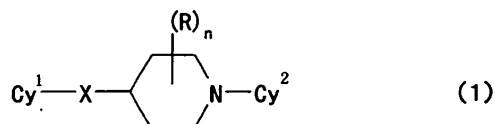
El documento US-A-5.001.125 describe piridazin aminas para el tratamiento de las enfermedades virales.

45 Exposición de la invenciónProblemas que debe solucionar la invención

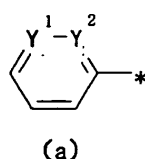
Un objetivo de la presente invención consiste en proporcionar agentes para el control de plagas, que pueden ser sintetizados industrialmente de manera favorable, que presenten excelentes bioactividades, que no presenten problemas con respecto a la seguridad y que presenten los compuestos con nuevas estructuras como principios activos.

Medios para solucionar el problema

5 Como resultado de una investigación intensiva para solucionar los problemas anteriormente mencionados, se descubrió que nuevos compuestos de aminas cíclicas con una estructura específica presentan unas actividades insecticidas/acaricidas excelentes para completar la presente invención. En otras palabras, la presente invención proporciona en primer lugar agentes para el control de plagas caracterizados porque contienen compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (1), sales de los mismos o N-óxidos de los mismos, como principios activos:



10 En la fórmula, Cy¹ representa un heterociclo de 5 miembros sustituido o no sustituido o un grupo sustituido o no sustituido representado por la fórmula (a) a continuación:



15 [En la fórmula, Y¹ e Y² cada uno independientemente representa nitrógeno o carbono y el símbolo (*) representa las posiciones de unión].

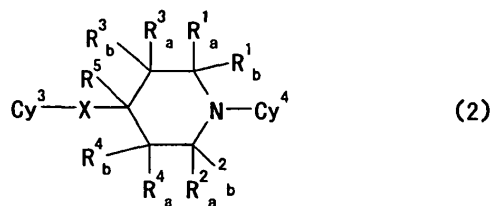
20 X representa oxígeno, azufre, sulfinilo, sulfonilo, nitrógeno sustituido o no sustituido.

Cada R puede unirse para formar un anillo y R que no se une para formar un anillo, representa un hidroxilo, halógeno, amino sustituido o no sustituido, nitro o un grupo orgánico.

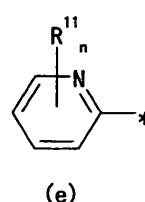
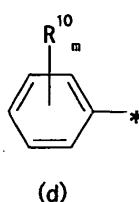
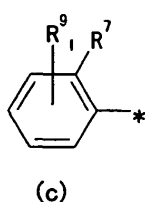
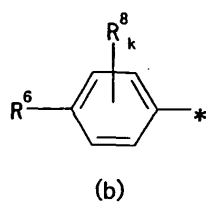
25 n es un entero de 0 a 9 y cada R puede ser igual o diferente cuando n es 2 o más.

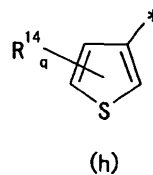
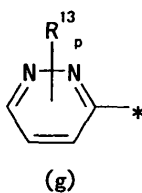
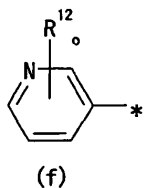
Cy² representa un hidrocarburo cíclico sustituido o no sustituido o un heterociclo sustituido o no sustituido con la condición de que Cy² sea piridin-2-ilo, que es sustituido con por lo menos uno o más ciano, cuando Cy¹ es un fenilo sustituido o no sustituido y Cy² es un piridin-2-ilo.

30 La presente invención proporciona en segundo lugar compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (2), sales de los mismos, o N-óxidos de los mismos.



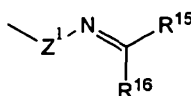
35 En la fórmula, Cy³ representa cualquiera de las fórmulas (b) a (h) a continuación.





En la fórmula, R⁶ representa haloalquilo o haloalcoxi.

- 5 R⁷ representa alcoxi sustituido o no sustituido, alcoxicarbonilo sustituido o no sustituido, alcoxilquilo sustituido o no sustituido, o el grupo funcional representado por la fórmula (i) a continuación.



(i)

- 10 [En la fórmula, R¹⁵ y R¹⁶ cada uno independientemente representa hidrógeno, hidrocarburo sustituido o no sustituido, un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, amino sustituido o no sustituido, hidrocarbonoxi o hidrocarbontio. R¹⁵ y R¹⁶ pueden unirse para formar un anillo, en ese caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo y Z¹ representa oxígeno o nitrógeno sustituido o no sustituido].

- 15 R⁸ a R¹⁴ cada uno independientemente representa hidroxilo, tiol, halógeno, nitro, formilo, ciano, haloalquilo, haloalcoxi, haloalquenilo, alquilo (opcionalmente sustituido con G¹), alcoxi (opcionalmente sustituido con G¹), alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, arilo (opcionalmente sustituido con G¹) o el grupo funcional representado por la fórmula (i).

G¹ representa hidroxilo, halógeno, amino sustituido o no sustituido nitro, o un grupo orgánico.

- 20 k, l, n y o, cada uno independientemente representa uno cualquiera de un entero de 0 a 4 y cada R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ y R¹², pueden ser iguales o diferentes, cuando k, l, n y o son 2 o más.

m es uno cualquiera de un entero de 0 a 5 y cada R¹⁰ puede ser igual o diferente cuando m es 2 o más.

- 25 p y q, cada uno independientemente, representan cualquiera de un entero de 0 a 3 y cada R¹³ y cada R¹⁴ puede ser igual o diferente cuando p y q son 2 o más.

X representa oxígeno, azufre, sulfinilo, sulfonilo o nitrógeno sustituido o no sustituido.

- 30 R^{1a} y R^{2a}, R^{1a} y R^{4a}, R^{2a} y R^{3a} o R^{3a} y R^{4a}, pueden formar juntos anillos saturados y R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} y R⁵, que no forman juntos anillos saturados, representan cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, amino sustituido o no sustituido, nitro o un grupo orgánico.

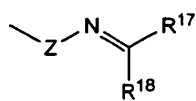
Cy⁴ representa:

- 35 - piridin-2-ilo sustituido con uno o más de ciano, piridin-3-ilo, piridazin-3-ilo, pirazinilo, tiazol-2-ilo, pirimidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo o fenilo, que son opcionalmente sustituidos con G² cuando Cy³ es un grupo funcional representado por las fórmulas (c), (g) o (h),

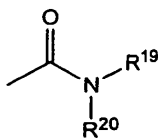
- 40 - piridin-2-ilo sustituido con uno o más de ciano, piridin-3-ilo, piridazin-3-ilo, pirazinilo, tiazol-2-ilo, pirimidin-2-ilo o 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, que son opcionalmente sustituidos con G² cuando Cy³ es un grupo funcional representado por las fórmulas (b), (e) o (f), y

- 45 - piridin-2-ilo sustituido con uno o más de ciano, pirazinilo o 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, que son opcionalmente sustituidos con G² cuando Cy³ es un grupo funcional representado por la fórmula (d).

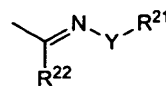
- 50 G² representa hidroxilo, halógeno, ciano, nitro, formilo, alquilo (opcionalmente sustituido con G³), alcoxi (opcionalmente sustituido con G³), haloalquilo, haloalcoxi, alquiltiocarbonilo, alquilsulfonilamino, haloalquil-sulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis-(haloalquilsulfonil)amino, alcoxicarbonilo, arilo (opcionalmente sustituido con G¹), un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros (que contiene por lo menos un heteroátomo entre oxígeno, nitrógeno y azufre), el grupo representado por las fórmulas (j) a (l).



(j)



(k)



(l)

En las fórmulas (j), (k) y (l), R¹⁷ y R¹⁸ cada uno independientemente representa hidrógeno, un hidrocarburo sustituido o no sustituido, un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, amino sustituido o no sustituido, hidrocarbonoxi o hidrocarbontio. R¹⁹ y R²², cada uno independientemente representa hidrógeno, un hidrocarburo sustituido o no sustituido, un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, o amino sustituido o no sustituido. R²⁰ representa hidrógeno o un hidrocarburo sustituido o no sustituido. R²¹ representa hidrógeno, un hidrocarburo sustituido o no sustituido o un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido. Y y Z cada uno independientemente representa oxígeno o nitrógeno sustituido o no sustituido. R¹⁷ y R¹⁸, R¹⁹ y R²⁰ y R²¹ y R²² pueden unirse para formar anillos y en ese caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo.

G³ representa hidroxilo, ciano, alcoxi, alcoxialcoxi o trialkilsililoxi.

Efectos de la invención

De acuerdo con la presente invención, es posible proporcionar agentes para el control de plagas con excelentes bioactividades, especialmente en términos de actividades insecticidas/acaricidas y gran seguridad, y además, es posible proporcionar compuestos de aminas cíclicas con una nueva estructura, sales de los mismos, o N-óxidos de los mismos.

Formas de realización preferidas de la invención

La presente invención se describirá en detalle a continuación:

I. Agentes para el control de plagas que contienen compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (1), sales de los mismos, o N-óxidos de los mismos, como principios activos.

Los agentes para el control de plagas de la presente invención están caracterizados porque contienen compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (1), sales de los mismos, o N-óxidos de los mismos, como principios activos. En la fórmula (1), Cy¹ es un grupo heterocíclico de 5 miembros sustituido o no sustituido o un grupo funcional sustituido o no sustituido representado por la fórmula (a).

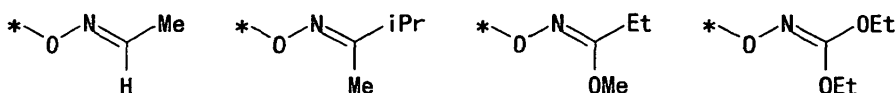
El grupo heterocíclico de 5 miembros no está limitado particularmente en tanto es un heterociclo de 5 miembros que tiene uno o más heteroátomos en el anillo y puede ser saturado o insaturado. Los ejemplos específicos del mismo incluyen pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazol-5-ilo, y resulta preferido el tiofen-3-ilo.

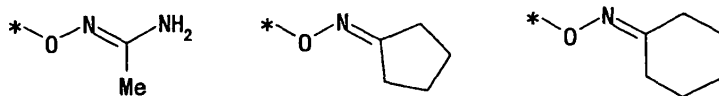
La fórmula (a) representa fenilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo o piridazin-3-ilo, que son sustituidos o no sustituidos y resulta preferido el fenilo sustituido o no sustituido.

Los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy¹ incluyen hidroxilo; tiol; halógeno, tal como flúor, cloro, bromo y yodo; ciano; nitro; formilo; amino sustituido o no sustituido tal como amino, metilamino, bencilamino, anilino, dimetilamino, dietilamino y feniletilamino; alquilo (preferentemente alquilo C₁₋₆) tal como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, s-butilo, isobutilo, t-butilo, n-pentilo y n-hexilo; alquenilo tal como vinilo, alilo y 2-metoxietenilo; alquinilo tal como etinilo, 1-propinilo, 2-feniletinilo y propargilo; alcoxi (preferentemente alcoxi C₁₋₆) tal como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, n-butoxi, sec-butoxi, isobutoxi y t-butoxi; alquinoxilo tal como viniloxi y aliloxi; alquinoxilo tal como etiniloxi y propargiloxi; ariloxi tal como fenoxi y benciloxi; heteroariloxi tal como 2-piridiloxi; haloalquilo (preferentemente haloalquilo C₁₋₆) tal como clorometilo, fluorometilo, bromometilo, diclorometilo, difluorometilo, dibromometilo, triclorometilo, trifluorometilo, bromodifluorometilo, 1,1,1-trifluoroetilo, 1-cloroetilo, 2-cloroetilo, 1-bromoetilo y 2-bromoetilo, pentafluoroetilo; haloalcoxi (preferentemente haloalcoxi C₁₋₆) tal como fluorometoxi, clorometoxi, bromometoxi, difluorometoxi, diclorometoxi, dibromometoxi, trifluorometoxi, triclorometoxi, tribromometoxi, 1,1,1-trifluoroetoxi, pentafluoroetoxi y heptafluoroisopropoxi; alquiltiocarbonilo (preferentemente alquiltiocarbonilo C₁₋₆) tal como metiltiocarbonilo, etiltiocarbonilo, propiltiocarbonilo, isopropiltiocarbonilo, n-butiltiocarbonilo, isobutiltiocarbonilo, s-butiltio-carbonilo y t-butiltiocarbonilo; alquilsulfonilamino (preferentemente alquilsulfonilamino C₁₋₆) tal como metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n-propil-sulfonilamino, isopropilsulfonilamino, n-butilsulfonilamino y t-butilsulfonilamino; arilsulfonilamino (preferentemente arilsulfonilamino C₆₋₁₂) tal como fenilsulfonilamino; heteroarilsulfonilamino (preferentemente heteroaril-sulfonilamino C₃₋₁₂) tal como

piperazinsulfonilamino; alquilcarbonilamino (preferentemente alquilcarbonilamino C₁₋₆) tal como metilcarbonilamino, etilcarbonilamino, n-propilcarbonilamino, e isopropilcarbonilamino; alcoxicarbonilamino (preferentemente alcoxicarbonilamino C₁₋₆) tal como metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, n-propoxicarbonilamino e isopropoxicarbonilamino; haloalquil-sulfonilamino (preferentemente haloalquilsulfonilamino C₁₋₆) tal como fluorometilsulfonilamino, clorometilsulfonilamino, bromometilsulfonilamino, difluorometilsulfonilamino, diclorometilsulfonilamino, difluoroetilsulfonilamino, trifluorometilsulfonilamino, 1,1,1-trifluoroetil-sulfonilamino y pentafluoroetilsulfonilamino; bis-(alquilsulfonil)amino (preferentemente bis(alquilsulfonil C₁₋₆)amino) tal como bis(metilsulfonil)amino, bis(etilsulfonil)amino, (etilsulfonil)(metilsulfonil)amino, bis(propilsulfonil)amino, bis(isopropilsulfonil)amino, bis(n-butilsulfonil)amino y bis(t-butilsulfonil)amino; bis(haloalquilsulfonil)amino (preferentemente bis-(haloalquilsulfonil C₁₋₆)amino) tal como bis(fluoro-metilsulfonil)amino, bis(clorometilsulfonil)amino, bis(bromometilsulfonil)amino, bis(difluorometil-sulfonil)amino, bis(diclorometilsulfonil)amino, bis(di-fluoroetilsulfonil)amino, bis(trifluorometilsulfonil)-amino, bis(1,1,1-trifluoroetilsulfonil)amino, y bis(pentafluoroetilsulfonil)amino; hidrazinometoxicarbonilo sustituido o no sustituido tal como hidrazino, N'-fenilhidrazino y N'-metoxicarbonilhidrazino; alcoxi-carbonilo (preferentemente alcoxicarbonilo C₁₋₆) tal como etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo y t-butoxicarbonilo; arilo (preferentemente arilo C₆₋₁₂) tal como fenilo, 1-naftilo y 2-naftilo; aralquilo (preferentemente aralquilo C₇₋₂₀) tal como bencilo y fenetilo; heterociclo de 5 miembros insaturado tal como furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazol-5-ilo; heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado tal como 5-fenil-5-trifluorometil-isoxazolin-3-ilo, 2-furfurilmetilo, 3-tienilmetilo y 1-metil-3-pirazolometilo; heterociclo de 6 miembros insaturado tal como piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo; heterociclo alquilo de 6 miembros insaturado tal como 2-piridilmetilo, 3-piridilmetilo, 6-cloro-3-piridilmetilo y 2-pirimidilmetilo; un grupo heterocíclico saturado tal como tetrahidrofuran-2-ilo, tetrahidropiran-4-ilo, piperidin-3-ilo, pirrolidin-2-ilo, morfolino, piperidino, y N-metilpiperazino; un grupo alquilo heterocíclico saturado tal como 2-tetrahidrafuranilmetilo, 3-piperazilmetilo, N-metil-3-pirrolidilmetilo y morfolinometilo; iminoalquilo N-sustituido o N-no sustituido tal como N-dimetilaminoiminometilo, 1-N-feniliminoetilo, N-hidroxiiminometilo, y N-metoxiiminometilo; hidrazinocarbonilo N-no sustituido o N-sustituido tal como N'-metilhidrazinocarbonilo, N'-fenilhidrazinocarbonilo e hidrazinocarbonilo; aminocarbonilo N-no sustituido o N-sustituido tal como aminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo y N-fenil-N-metilaminocarbonilo; hidrazino N-no sustituido o N-sustituido tal como hidrazino, N'-acetilhidrazino, N'-metilhidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxi-carbonilhidrazino y N'-2-propilidenedhidrazino; alquiltio tal como metiltio, etiltio y t-butiltio; alqueniltio tal como viniltio y aliltio; alquiniltio tal como etiniltio y propargiltio; ariltio tal como feniltio y 4-clorofeniltio; heteroariltio tal como 2-piridiltio; aralquiltio tal como benciltio y fenetiltio; alquilsulfonilo tal como metilsulfonilo, etilsulfonilo y t-butilsulfonilo; alquenilsulfonilo tal como alilsulfonilo; alquilsulfonilo tal como propargilsulfonilo; arilsulfonilo tal como fenilsulfonilo; heteroarilsulfonilo tal como 2-piridilsulfonilo y 3-piridilsulfonilo; aralquilsulfonilo tal como bencilsulfonilo; y grupos funcionales representados por la fórmula (i). Asociando dos o más sustituyentes mencionados anteriormente, sustituyendo un sustituyente por otro, se puede utilizar el sustituyente resultante de una manera similar como un nuevo sustituyente.

Los ejemplos específicos de hidrocarburos en la fórmula (i) incluyen alquilo tal como metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-hexilo y n-octilo; alquenilo tal como vinilo, alilo, 1-propenilo y 2-feniletlenilo; alquinilo tal como etinilo y propargilo; e hidrocarburos aromáticos tales como fenilo, 1-naftilo y 9-antracel. Los ejemplos específicos de grupos heterocíclicos incluyen heterociclos de 5 miembros insaturados tales como furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazol-5-ilo; heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado tal como 5-fenil-5-trifluorometil-isoxazolin-3-ilo, 2-furfurilmetilo, 3-tienilmetilo y 1-metil-3-pirazolometilo; heterociclo de 6 miembros insaturado tal como piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo; heterociclo alquilo de 6 miembros insaturado tal como 2-piridilmetilo, 3-piridilmetilo y 6-cloro-3-piridilmetilo; y heterociclos saturados tales como tetrahidrofuran-2-ilo, tetrahidrapiran-4-ilo, piperidin-3-ilo, pirrolidin-2-ilo, morfolino, piperidino y N-metilpiperazino; un heterociclo alquilo saturado tal como 2-tetrahidfuranilmetilo, 3-piperazilmetilo, N-metil-3-pirrolidilmetilo y morfolinometilo. Los ejemplos específicos de hidrocarbonoxi e hidrocarbontio incluyen metoxi, etoxi, isopropoxi, fenoxi, benciloxi, 2-piridiloxi, metiltio, etiltio, feniltio, benciltio y 2-piridiltio. Los ejemplos específicos de sustituyentes de grupos funcionales presentes en R⁶ y R⁷ incluyen los mismos que los mostrados como ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy¹. Los ejemplos específicos de grupos funcionales representados por la fórmula (i) incluyen los grupos funcionales representados por las fórmulas a continuación:





Y¹ e Y², cada uno independientemente, representa nitrógeno o carbono.

5 X representa oxígeno; azufre, nitrógeno no sustituido o nitrógeno sustituido con los mismos sustituyentes que los mencionados como ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy¹; sulfínico; o sulfónico, y resulta particularmente preferido el oxígeno.

10 Cada R puede formar anillos saturados juntos y resulta preferida la unión de los de las segunda y sexta posiciones y en las tercera y quinta posiciones del anillo de piperidina para formar anillos saturados, y el número de átomos en el sitio de entrecruzamiento, que forma el anillo saturado, es preferentemente 2 o 3. Además, los elementos que constituyen el sitio de entrecruzamiento del anillo saturado no están particularmente limitados en tanto estén comprendidos en un rango químicamente aceptable y los ejemplos específicos de los mismos incluyen carbono, 15 oxígeno, azufre, nitrógeno o silicio y los anillos saturados pueden ser constituidos combinando 2 o más de estos elementos dentro de un rango químicamente aceptable. Además, cada átomo puede tener hidrógeno o sustituyentes dentro del rango químicamente aceptable en el mismo y R¹_a y R²_a, R¹_a y R⁴_a, R²_a y R³_a o R³_a y R⁴_a, pueden ligar oxígeno, azufre, o nitrógeno a través de un doble enlace dentro de un rango químicamente aceptable para formar carbonilo, tiocarbonilo, imino, o similares.

20 R que no forma los anillos saturados anteriormente mencionados juntos, cada uno independientemente, representa hidrógeno, halógeno, amino sustituido o no sustituido, nitro, hidroxilo o un grupo orgánico. Los ejemplos específicos del grupo orgánico incluyen ciano; formilo; alquilo; alcoxicarbonilo; alcoxi; haloalquilo; haloalcoxi; alquiltiocarbonilo; alquilsulfonilamino; haloalquil-sulfonilamino; bis(alquilsulfonil)amino; bis(haloalquil-sulfonil)amino; alcoxicarbonilo y arilo. Como grupos orgánicos, resultan preferidos alquilo; alcoxicarbonilo y alcoxi, y resultan más preferidos alquilo 25 C₁₋₆; alcoxicarbonilo C₁₋₆ y alcoxi C₁₋₆. Los ejemplos específicos de los mismos incluyen los mismos que los mostrados como una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy¹.

n es un entero de 0 a 9 y cada R puede ser igual o diferente cuando n es 2 o más.

30 Además, cada R puede unirse para formar un anillo y el número de átomos en el sitio de entrecruzamiento, que forma el anillo saturado, es preferentemente 2 o 3.

35 Cy² representa un hidrocarburo cíclico sustituido o no sustituido, o un heterociclo sustituido o no sustituido. Los ejemplos específicos de los mismos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como fenilo, naftil-1-ilo y naftil-2-ilo; y anillos heteroaromáticos tales como furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazol-5-ilo; piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo; y resulta preferido el piridazin-3-ilo. Los ejemplos específicos de los anillos no aromáticos incluyen cicloalquilo tales como ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo; y heterociclos saturados tales como piperidino, 2-piperidilo, 3-piperidilo, 4-piperidilo, 2-tetrahidrofurano, 3-tetrahidrofurano, 2-tetrahidro-pirano, 3-tetrahidropirano, 4-tetrahidropirano, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolinilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 2-piperazinilo, 3-piperazinilo y 4-piperazinilo, y resulta particularmente preferido el piridazin-3-ilo. 40

45 Los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy² incluyen sustituyentes iguales a los ejemplos específicos de Cy¹. Es con la condición de que Cy² sea un piridin-2-ilo sustituido con uno o más ciano cuando Cy¹ es un fenilo sustituido o no sustituido y Cy² es un piridin-2-ilo sustituido. Cy² no incluye piridin-2-ilo no sustituido, cuando Cy¹ es un fenilo sustituido o no sustituido. El piridin-2-ilo que es sustituido con un ciano puede tener un sustituyente distinto de ciano.

II. Nuevos compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (2)

55 En los nuevos compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (2) (que se puede denominar a continuación "compuesto (2)"), Cy³ es un grupo funcional representado por una cualquiera de las fórmulas (b) a (h).

En la fórmula (b), los ejemplos específicos de R⁶ incluyen sustituyentes iguales a una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy¹.

60

Los ejemplos específicos de R^7 en la fórmula (c) incluyen alcoxi (en particular preferentemente alcoxi C_{1-6}) y alcoxycarbonilo (en particular preferentemente alcoxycarbonilo C_{1-6}) que son iguales a una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 , un grupo funcional representado por la fórmula (i), que es la misma que anteriormente; y alcoxialquilo (en particular preferentemente alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6}) tal como metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, 1-metoxietilo, 2-metoxietilo, 1-etoxietilo, 2-etoxietilo, 1-propoxietilo, 2-propoxietilo, 1-metoxipropilo, 2-metoxipropilo y 3-metoxipropilo.

Los ejemplos específicos de R^8 a R^{14} incluyen aquellos iguales a una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 .

Los ejemplos específicos de G^1 , que pueden ser un sustituyente de una parte de R^8 a R^{14} incluyen aquellos iguales a una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 .

Los ejemplos específicos de los sustituyentes de nitrógeno incluyen aquellos iguales a los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 cuando X es nitrógeno opcionalmente sustituido.

Además, R^1_a y R^2_a y R^1_a y R^4_a y R^2_a y R^3_a o R^3_a y R^4_a pueden formar anillos saturados juntos y resulta preferido que R^1_a y R^2_a o R^3_a y R^4_a se unan para formar un anillo cuando forman anillos saturados y el número de átomos en el sitio de entrecruzamiento, que forma el anillo saturado, es preferentemente 2 o 3. Además, los elementos que constituyen el sitio de entrecruzamiento del anillo saturado no están particularmente limitados en tanto estén comprendidos en un rango químicamente aceptable y ejemplos específicos de los mismos incluyen carbono, oxígeno, azufre, nitrógeno o silicio y los anillos saturados pueden ser constituidos combinando 2 o más de estos elementos dentro de un rango químicamente aceptable. Además, cada átomo puede tener hidrógeno o sustituyentes dentro del rango químicamente aceptable en el mismo y R^1_a y R^2_a , R^1_a y R^4_a , R^2_a y R^3_a o R^3_a y R^4_a , pueden ligar oxígeno, azufre, o nitrógeno a través de un doble enlace dentro de un rango químicamente aceptable para formar carbonilo, tiocarbonilo, imino, o similares.

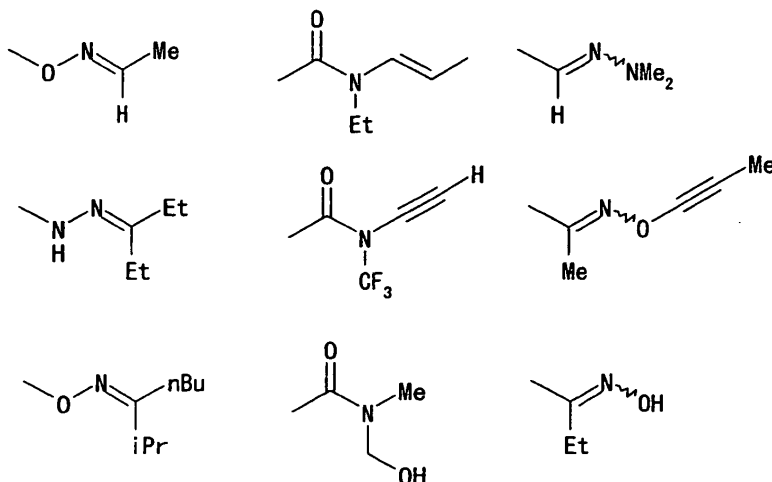
R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , y R^5 , que no forman juntos anillos saturados, representan cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, amino sustituido o no sustituido, nitro, hidroxilo o un grupo orgánico. El grupo orgánico representa grupos funcionales que contienen carbono y los ejemplos específicos de los mismos incluyen ciano; formilo; alquilo; alcoxycarbonilo; alcoxi; haloalquilo; haloalcoxi; alquiltiocarbonilo; alquil-sulfonilamino; haloalquilsulfonilamino; bis(alquil-sulfonil)amino; bis(haloalquilsulfonil)amino; alcoxi-carbonilo; y arilo. Como el grupo orgánico, resultan preferidos alquilo; alcoxycarbonilo y alcoxi, y más preferidos alquilo C_{1-6} ; alcoxycarbonilo C_{1-6} y alcoxi C_{1-6} . Además los ejemplos específicos de los mismos incluyen los mismos que los mostrados como una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 .

Una parte de los ejemplos específicos de G^2 en Cy^4 incluye aquellos iguales que una parte de los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 . Los ejemplos específicos de hidrocarburos comúnmente presentes en R^{17} a R^{22} , en las fórmulas (j) a (l) en G^2 incluyen alquilo tal como metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-hexilo y n-octilo; alqueno tal como vinilo, alilo, 1-propenilo y 2-feniletlenilo; alquino tal como etinilo y propargilo; e hidrocarburos aromáticos tales como fenilo, 1-naftilo y 9-antracel.

Los ejemplos específicos de grupos heterocíclicos comúnmente presentes en R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{21} y R^{22} incluyen heterociclos de 5 miembros insaturados tales como furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-5-ilo, 5-fenil-5-trifluorometil-isoxazolin-3-ilo; heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado tal como 2-furfurilmetilo, 3-tienilmetilo y 1-metil-3-pirazolometilo; heterociclos de 6 miembros insaturados tal como piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo; heterociclo alquilo de 6 miembros insaturado tal como 2-piridilmetilo, 3-piridilmetilo, 6-cloro-3-piridilmetilo y 2-pirimidilmetilo; y heterociclos saturados tales como tetrahidrofuran-2-ilo, tetrahidrapiran-4-ilo, piperidin-3-ilo, pirrolidin-2-ilo, morfolino, piperidino y N-metilpiperazinilo; heterociclo alquilo saturado tal como 2-tetrahidrofuranilmetilo, 3-piperazilmetilo, N-metil-3-pirrolidilmetilo y morfolinometilo. Los ejemplos específicos de hidrocarbonoxi e hidrocarbontio comúnmente presentes en R^{17} y R^{18} incluyen metoxi, etoxi, isopropoxi, fenoxi, benciloxi, 2-piridiloxi, metiltio, etiltio, feniltio, benciltio y 2-piridiltio. Los ejemplos específicos de sustituyentes de grupos funcionales presentes en R^{17} a R^{22} incluyen los mismos que los mostrados como ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 . Y y Z, cada uno independientemente, representa oxígeno o nitrógeno sustituido o no sustituido y los ejemplos específicos de un sustituyente en nitrógeno incluyen los mismos que los mostrados como no ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 .

Los ejemplos específicos de G^3 como un sustituyente de alquilo y alcoxi en G^2 incluyen hidroxilo; ciano; alcoxi (preferentemente alcoxi C_{1-6}), lo mismo que los ejemplos específicos de los sustituyentes de Cy^1 ; alcoxialcoxi (preferentemente alcoxi C_{1-6} alcoxialcoxi C_{1-6}) tal como metoximetoxi, etoximetoxi y propoxietoxi; y trialkilsililoxi (preferentemente trialkilsililoxi C_{1-6}), tal como trimetilsililoxi, triisopropilsililoxi, y diisopropilmetilsililoxi.

Los ejemplos específicos de las fórmulas (j) a (l) incluyen las fórmulas presentadas a continuación.



5 Como N-óxidos de los compuestos representados por las fórmulas (1) y (2), se pueden mostrar como ejemplos los compuestos en donde nitrógeno en las partes de aminas cíclicas o nitrógeno en el heterociclo que contiene nitrógeno de los compuestos representados por las fórmulas (1) y (2) es oxidado, o similares.

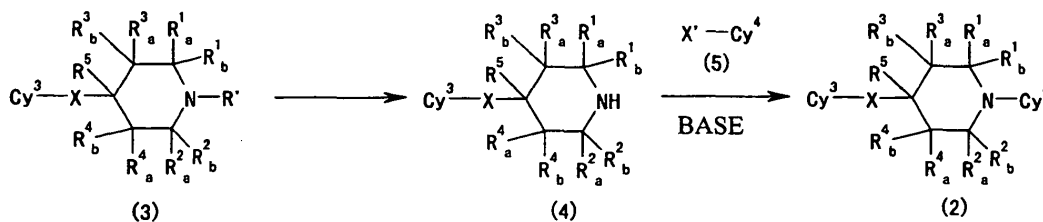
10 Además, los ejemplos de sales de los compuestos representados por las fórmulas (1) y (2) incluyen sales de ácidos inorgánicos tales como sales clorhidrato, sales nitrato, sales sulfato y sales fosfato; y sales de ácidos orgánicos tales como sales acetato, sales lactato, sales propionato y sales benzoato.

III. (Método de producción).

15 El método de producción de los compuestos (1) y (2) se describirá a continuación. Debería apreciarse que aunque la descripción está prevista a continuación proporcionando el compuesto (2) a título de ejemplo, el compuesto (1) también puede ser producido de una manera similar al del compuesto (2).

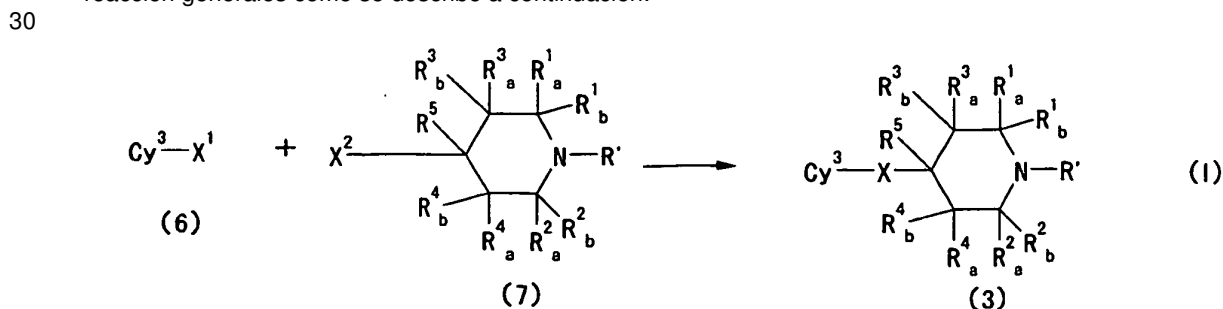
1) Cuando X es oxígeno o azufre opcionalmente oxidado

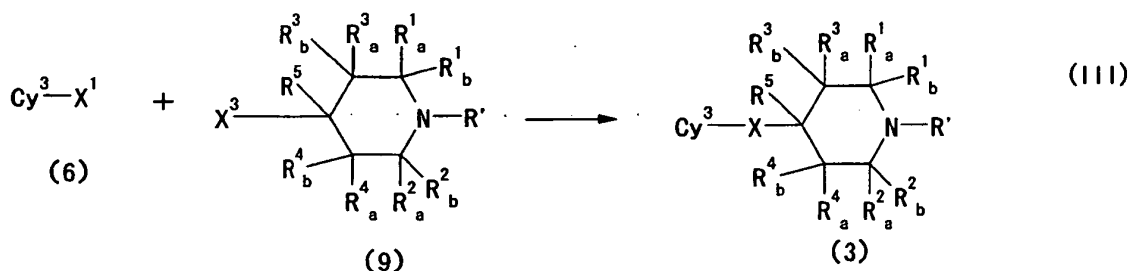
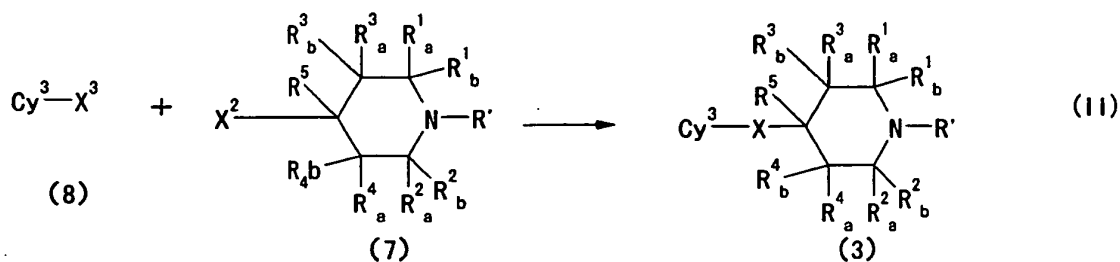
20 El compuesto (2) puede ser obtenido, por ejemplo, sometiendo el compuesto representado por la fórmula (3) (denominado a continuación el "compuesto (3)") a desprotección general y acoplamiento como se muestra a continuación:



25 (En la fórmula Cy^3 , Cy^4 , X, R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , y R^5 , son los mismos que los indicados anteriormente. X' representa un grupo saliente tal como halógeno y R' representa un grupo protector).

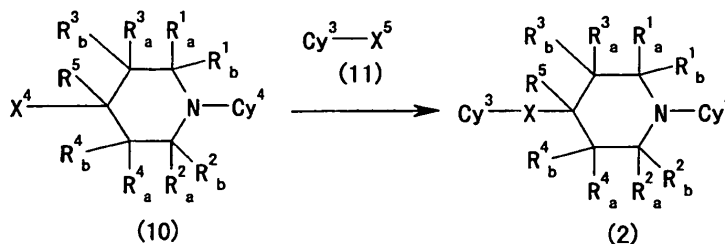
El compuesto (3), que es un producto intermedio durante la producción puede ser producido por condiciones de reacción generales como se describe a continuación:





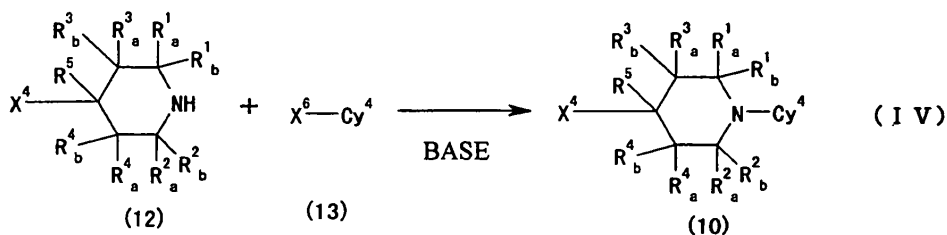
5 (En la fórmula, Cy^3 , X , R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , R^5 , y R' son los mismos que los indicados anteriormente. X^1 y X^2 cada uno independientemente representa hidroxilo o mercapto y X^3 representa un grupo saliente tal como halógeno).

Además, el compuesto (2) también puede ser producido por el método general presentado a continuación.



10 (En la fórmula Cy^3 , Cy^4 , X , R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , y R^5 , son los mismos que los indicados anteriormente. X^4 representa un grupo saliente tal como halógeno y X^5 representa hidroxilo o mercapto).

15 El compuesto (10), que será una materia prima, también puede ser producido por el método general mostrado en la fórmula de reacción (IV) a continuación:

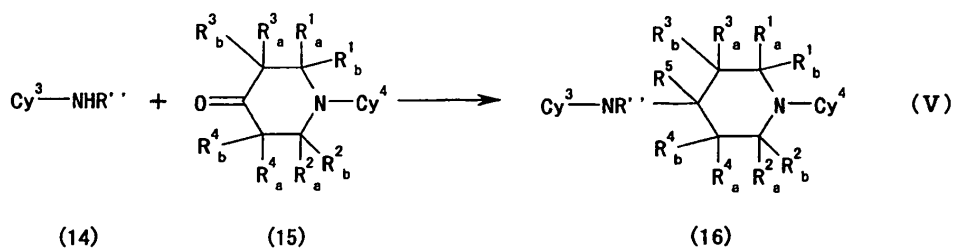


20 (En la fórmula Cy^4 , X^4 , R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , y R^5 , son los mismos que los indicados anteriormente. X^6 representa un grupo saliente tal como halógeno).

(2) Cuando X es nitrógeno opcionalmente sustituido

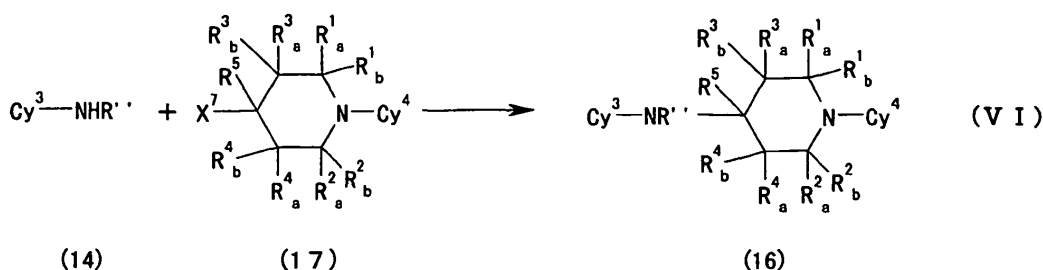
Los compuestos representados por la fórmula (16) (denominados a continuación "compuesto (16)") pueden ser producidos por el método general como se muestra en la fórmula de reacción (V) a continuación:

25



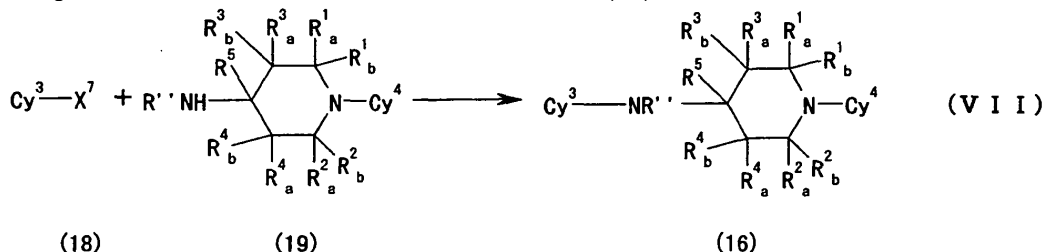
(En la fórmula Cy^3 , Cy^4 , R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , y R^5 son los mismos que los indicados anteriormente. R'' representa un sustituyente en nitrógeno tal como hidrógeno, trifluoroacetilo o trifluorometilsulfonilo.

5 El compuesto (16), que es un compuesto de la presente invención, también puede ser producido por la reacción general como se muestra en la fórmula de reacción (VI) a continuación:



10 (En la fórmula Cy^3 , Cy^4 , R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , R^5 , y R'' son los mismos que los indicados anteriormente. X^7 representa un grupo saliente tal como halógeno y sulfonilo).

El compuesto (16), que es un compuesto de la presente invención, también puede ser producido por la reacción de acoplamiento general como se muestra en la fórmula de reacción (VII) a continuación:



15 (En la fórmula Cy^3 , Cy^4 , X^7 , R^1_a , R^1_b , R^2_a , R^2_b , R^3_a , R^3_b , R^4_a , R^4_b , R^5 , R'' y X^7 son los mismos que los indicados anteriormente).

20 IV. Agentes para el control de plagas caracterizados porque contienen compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (1) o (2), sales de los mismos o N-óxidos de los mismos, como principios activos

25 Los compuestos de la presente invención (los compuestos representados por las fórmulas (1) y (2), sales de los mismos, o N-óxidos de los mismos) tienen excelentes actividades adulticidas, ninficidas, larvicidas u ovicidas, y pueden ser usados para controlar plagas en agricultura, insectos sanitarios, insectos de plagas de granos almacenados, plagas de prendas de vestir, plagas domésticas, o similares. Los ejemplos significativos de los mismos incluyen los siguientes.

30 Las plagas que pertenecen al orden *Lepidoptera* tal como *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, gusanos verdes, *Autographa nigrisigna*, *Plutella xylostella*, *Adoxophyes honmai*, *Homona magnanima*, *Carposina sasakii*, *Grapholita molesta*, *Phyllocnistis citrella*, *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoniella*, *Lymantria dispar*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Ostrinia nubilalis*, *Hyphantria cunea*, *Cadra cautella*, género *Heliothis*, género *Helicoverpa*, género *Agrothia*, *Tinea translucens*, *Cydia pomonella*, y *Pectinophora gossypiella*;

35 plagas que pertenecen al orden *Hemiptera* tales como *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Lipaphis erysimi*, *Rhopalosiphum padi*, *Riptortus clavatus*, *Nezara antennata*, *Unaspis yanonensis*, *Pseudococcus comstocki*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Bemisia argentifolii*, *Psylla pyrisuga*, *Stephanitis nashi*, *Nilaparvata lugens*, *Ladelphax stratella*, *Sogatella furcifera* y *Nephotettix cincticeps*;

5 plagas que pertenecen al orden *Coleoptera* tales como *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Sitophilus zeamais*, *Callosobruchus chinensis*, *Popillia japonica*, *Anomala rufocuprea*, género *Diabrotica*, *Lasioderma serricorne* *Lyctus brunneus*, *Monochamus alternatus*, *Anoplophora malasiaca*, género *Agriotis*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Tenebroides mauritanicus* y *Anthonomus grandis*;

10 plagas que pertenecen al orden *Diptera* tales como *Musca domestica*, *Calliphora lata*, *Boettcherisca peregrine*, *Zeugodacus cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Delia platura*, *Agromyza oryzae*, *Drosophila melanogaster*, *Stomoxys calcitrans*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Aedes aegypti* y *Anopheles sinensis*;

10 plagas que pertenecen al orden *Thysanoptera* tales como *Thrips palmi* y *Scirtothrips dorsalis*;

15 plagas que pertenecen al orden *Hymenoptera* tales como *Monomorium pharaonis*, *Vespa simillima xanthoptera* y *Athalia rosae ruficornis*;

15 plagas que pertenecen al orden *Orthoptera* tales como *Locusta migratoria*, *Blatella germanica*, *Periplaneta americana* y *Periplaneta fuliginosa*;

20 plagas que pertenecen al orden *Isoptera* tales como *Coptotermes formosanus* y *Reticulitermes speratus speratus*;

20 plagas que pertenecen al orden *Siphonaptera* tales como *Pulex irritans* y *Ctenocephalides felis felis*;

25 plagas que pertenecen al orden *Phthiraptera* tales como *Pediculus humanus*; *Acarina* tales como *Tetranychus urticae*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Aculops pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, *Polyphagotarsonemus latus*, género *Brevipalpus*, género *Eotetranychus*, *Rhizoglyphus robini*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Boophilus microplus* y *Haemaphysalis longicornis*; y

30 nematodos parásitos de las plantas tales como *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus* spp., *Heterodera glycines*, *Aphelenchoides besseyi* y *Bursaphelenchus xylophilus*.

30 Las plagas a las que se aplica preferentemente la presente invención son las plagas que pertenecen al orden *Lepidoptera*, plagas que pertenecen al orden *Hemiptera*, *Acarina*, plagas que pertenecen al orden *Thysanoptera* y plagas que pertenecen al orden *Coleoptera*, y en particular preferentemente *Acarina*.

35 Además, se desean las medicinas que también son efectivas para plagas o *Acarina* que son de linaje resistente debido a que en los últimos años la resistencia que se desarrolló a los plaguicidas organofosforados, los plaguicidas de carbamato o los acaricidas entre muchas plagas tales como *Plutella xylostella*, *Delphacidae*, *Deltoccephalidae* y *Aphididae*, ha causado problemas debido a efectos insuficientes de estas medicinas. Los compuestos de la presente invención son medicinas que tienen excelentes efectos insecticidas y acaricidas no sólo sobre las plagas de linajes

40 sensibles sino también en plagas de linajes resistentes a los plaguicidas organofosforados, plaguicidas de carbamato y plaguicidas piretroides, y en *Acarina* de linajes resistentes a los acaricidas.

45 Los compuestos de la presente invención son medicinas que muestran menos daños por herbicidas, tienen menor toxicidad para los peces y los animales de sangre caliente, y mayor seguridad.

45 Los compuestos de la presente invención también se pueden usar como antiincrustantes para evitar que organismos acuáticos se adhieran a objetos que están en contacto con el agua, tales como las partes inferiores de los barcos y las redes de pesca.

50 Además, algunos de los compuestos de la presente invención presentan actividades microbicidas, actividades herbicidas, o actividades reguladoras del crecimiento de las plantas. Además, algunos productos intermedios de los compuestos de la presente invención presentan actividades insecticidas/acaricidas.

55 Aunque los compuestos de la presente invención son, huelga decirlo, suficientemente efectivos aún cuando se usan solos, también pueden ser usados mezclando o combinando con uno o más de otros agentes para el control de plagas, germicidas, insecticidas/acaricidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, sinérgicos, fertilizantes, acondicionadores del suelo, alimento para animales, o similares.

60 Los ejemplos representativos de principio activos de germicidas, acaricidas, reguladores del crecimiento de plantas, o similares, que se pueden usar mezclando o combinando con compuestos de la presente invención, se muestran a continuación.

Germicidas:

65 captano, folpet, tiuram, ziram, zineb, maneb, mancozeb, propineb, policarbamato, clorotalonin, quintozeno, captafol, prodiona, procimidona, fluoroimida, mepronil, flutolanil, pencicurón, oxicarboxin, fosetil-aluminio, propanocarb,

5 triadimefon, triadimenol, propiconazol, diclobutrazol, bitertanol, hexaconazol, miclobutanil, flusilazol, etaconazol, fluotrimazol, flutriafen, penconazol, diniconazol, ciproconazol, fenarimol, triflumizol, procloraz, imazalil, pefurazoato, tridemof, fenpropimorf, triforina, butiobato, pirifenox, anirazina, polioxinas, metalaxil, oxadixil, furalaxil, isoprotiolano, probenazol, pirrolnitrina, blastidina S, kasugamicina, validamicina, sulfato de dihidroestreptomicina, benomil, carbendazim, tiofanato-metilo, himexazol, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico, fentinacetato, hidróxido de trifenilestaño, dietofencarb, quinometionato, binapacril, lecitina, bicarbonato, ditianon, dinocap, fenaminosulf, diclomezina, guazatina, dodina, IBP, edifenfos, mepanipirim, fermzona, triclámda, metasulfocarb, fluazinam, etoquinolac, dimetomorf, piroquilon, teclotalam, ftálda, óxido de fenazina, tiabendazol, tricicazol, vinclozolin, cimoxanil, ciclobutanil, guazatina, clorhidrato de propamocarb, ácido oxolínico, ciflufenamid, iminoctadina, kresoxim-metilo, triazina, fenhexamida, ciazofamida, ciprodinil, protioconazol, fenbuconazol, trifloxiestrobina, azoxiestrobina, hexaconazol, imibenconazol, tebuconazol, difenoconazol, y carpropamida;

Insecticidas/acaricidas:

15 plaguicidas organofosforados y de carbamato:

20 fentión, fenitrotión, diazinona, clorpirifos, ESP, vamidotión, fentoato, dimetoato, formotión, malatión, triclorfón, tiometón, fosmet, diclorvos, acefato, EPBP, metil paratión, oxidemetón metilo, etiión, salitión, cianofos, isoxantiión, piridafentión, fosalona, metidatión, sulprofos, clorfenvinfos, tetraclorvinfos, dimetilvinfos, propafos, isofenfos, etiltiometón, profenofos, piraclafos, monocrotofos, azinfos-metilo, aldicarb, metomilo, tiodicarb, carbofurano, carbosulfano, benfuracarb, furatiocarb, propoxur, BMPC, MTMC, MIPC, carbarilo, pirimicarb, etiofencarb, fenoxicarb, cartap, tiociclam, bensultap, y similares;

25 plaguicidas piretroides:

permetrina, cipermetrina, deltametrina, fenvalerato, fenpropatrina, piretrina, aletrina, tetrametrina, resmetrina, dimetrina, propatrina, fenotrina, protrina, fluvalinato, ciflutrina, cihalotrina, flucitrinato, etofenprox, cicloprotrina, tralometrina, silafluofen, y acrinatrina;

30 benzoilurea y otros plaguicidas:

35 diflubenzurón, clorfluazurón, hexaflumurón, triflumurón, flufenoxurón, flucicloxurón, buprofezina, piriproxifeno, metopreno, benzoepina, diafenturón, imidacloprid, fipronil, sulfato de nicotina, rotenona, metaldehído, acetamiprid, clorfenapir, nitenpiram, tiacloprid, clotianidina, tiametoxam, dinotefuran, indoxacarb, pimetozina, espinosad, emamectina, piridalilo, tebufenozida, cromafenozida, metoxifenozida, tolfenpirad, aceite de máquinas, plaguicidas microbianos tales como BT y virus entomopatógenos;

nematicidas:

40 fenamifos, fostiazato, cadusafos, y similares;

acaricidas:

45 clorobencilato, fenisobromolato, dicofol, amitraz, BPPS, benzomato, hexitiazox, óxido de fenbutatina, polinactina, quinometionato, CPCBS, tetradifón, avermectina, milbemectina, clofentezina, cihexatina, piridaben, fenpiroximato, tebufenpirad, pirimidifen, fenotiocarb, dienoclor, fluacripirim, acequinocil, bifenazato, etoxazol, espiroclifofén, fenazaquina, y similares;

reguladores del crecimiento de las plantas:

50 giberelinas (por ejemplo, giberelina A3, giberelina A4, o giberelina A7), IAA, NAA, o similares.

Los agentes para el control de plagas de la presente invención contienen uno o más compuestos de la presente invención como un principio activo.

55 Aunque los compuestos de la presente invención se pueden usar como tales, sin agregar ningún otro componente como agente para el control de plagas, pueden ser formulados para su uso. En otras palabras, mezclando por lo menos uno de los compuestos de la presente invención con vehículos sólidos, líquidos o gaseosos, o impregnando por lo menos uno de los compuestos de la presente invención en sustratos tales como placas cerámicas porosas y telas no tejidas, y agregando tensioactivos u otros adyuvantes en donde sea necesario, los compuestos son formulados, con el objetivo de usarlos como agroquímicos, en la forma que los agroquímicos generales pueden adoptar y pueden ser usados.

65 Los ejemplos de formulaciones agroquímicas incluyen polvo humectable, gránulos, polvo para espolvorear, emulsión, polvo soluble en agua, agente de suspensión, polvo humectable granulado, fluido, aerosol, agente de transpiración por calentamiento, fumigante, cebo envenenado, microcápsula, o similares.

5 Como aditivos y vehículos, se usan polvos vegetales tales como harina de soja y harina de trigo; polvo mineral fino tal como tierra de diatomeas, apatita, yeso, talco, bentonita, pirofilita y arcilla; y compuestos orgánicos e inorgánicos tales como benzoato de sodio, urea y sulfato de sodio, cuando se requiere una formulación sólida. Cuando se requiere una formulación en forma líquida, se usan como solventes fracciones de petróleo tales como queroseno, xileno y nafta solvente, y ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, alcohol, acetona, metil isobutil cetona, aceite mineral, aceite vegetal, agua, o similares. Como vehículos gaseosos usados en propulsores, se pueden usar butano (gas), LPG, dimetil éter y gas dióxido de carbono.

10 Como sustrato de cebo envenenado, se pueden usar componentes de cebo tales como polvo de granos, aceite vegetal, azúcar y celulosa cristalina; antioxidantes tales como dibutilhidroxitolueno y ácido nordihidroguaiarético; conservantes tales como ácido dehidroacético; agentes para evitar la ingestión accidental por niños o mascotas tales como pimentón; y olores que atraen a los insectos de plagas tales como olores de queso y olores de cebolla.

15 Adicionalmente, para lograr formas homogéneas y estables en estas formulaciones, también es posible agregar tensioactivos si es necesario. Aunque los tensioactivos no están limitados particularmente, los ejemplos de los mismos incluyen, por ejemplo, tensioactivos no iónicos tales como alquil éter en donde se agrega polioxietileno, éster de ácidos grasos superiores en donde se agrega polioxietileno, éster de ácidos grasos superiores de sorbitán en donde se agrega polioxietileno, y triestiril fenil éter en donde se agrega polioxietileno; sal éster sulfato de alquil fenil éter en donde se agrega polioxietileno, sal sulfonato de alquil naftaleno, sal policarboxilato, sal sulfonato de lignina, condensado formaldehído de alquil naftaleno sulfonato y copolímero de isobutileno-anhídrido maleico.

25 Cuando los compuestos de la presente invención se usan como agentes para el control de plagas en agricultura, la cantidad de principio activo en las formulaciones es de 0,01 a 90% en peso y en particular preferentemente 0,05 a 85% en peso y polvo humectable, emulsión, agentes de suspensión, agentes fluidos, polvo soluble en agua, polvo humectable granulado, que son diluidos a concentraciones predeterminadas con agua, y polvo para espolvorear y gránulos como tales, pueden ser aplicados sobre plantas y suelos.

30 Además, cuando los compuestos de la presente invención se usan como agentes para el control de plagas con propósitos de cuarentena, se aplican emulsión, polvo humectable, agentes fluidos y similares, diluyendo a concentraciones predeterminadas con agua, y solución oleosa, aerosol, cebo envenenado, lámina antiácaros y similares, se pueden aplicar como tales.

35 Cuando los compuestos de la presente invención se usan como agentes para el control de plagas para controlar ectoparásitos del ganado, tal como ganado vacuno y porcino, o de mascotas tales como perros y gatos, se usan formulaciones que utilizan los compuestos de la presente invención en métodos conocidos en el campo de la medicina veterinaria. Como tales métodos, los ejemplos de los mismos incluyen un método para administrar en formas tales como comprimidos, cápsulas, líquido para inmersión, mezcla de forraje, supositorios e inyecciones (intramuscular, subcutánea, endovenosa, intraperitoneal, o similares) cuando se requiere control sistémico y un método para administrar por pulverización, para verter, o aplicar puntualmente formulaciones líquidas acuosas u oleosas, o un método para colocar objetos, que son formulaciones de resina conformadas como collares, etiquetas para las orejas, o similares, cuando se requiere un control no sistémico. En este caso, se puede usar la proporción usada normalmente, en donde se aplican 0,01 a 1.000 mg de los compuestos de la presente invención por 1 kg de animal huésped.

Ejemplo

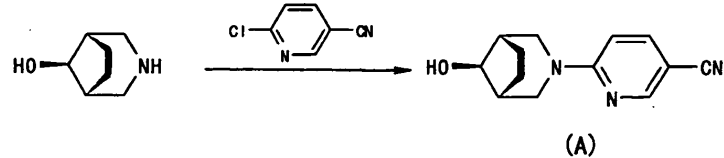
A continuación se describirá la presente invención con mayor detalle a partir de los ejemplos. Sin embargo, la presente invención no está limitada a los ejemplos indicados a continuación en cualquiera de los aspectos.

Ejemplo de producción 1

Producción de 8β-[2-isopropilidenaminooxi-4-(tri-fluorometil)-fenoxi]-3-(5-ciano-piridin-2-il)-3-azabicyclo-[3.2.1]-octano (E)

Etapa 1

Producción de 8β-hidroxi-3-(5-ciano-piridin-2-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (A)

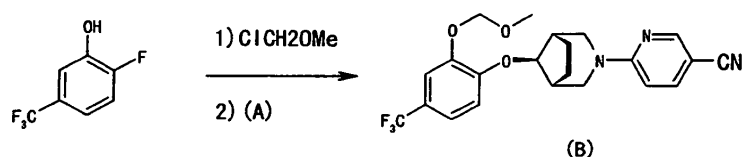


60

Se sometieron a reflujo con calentamiento durante la noche 5 ml de una suspensión de acetonitrilo que contenía 0,15 g de 3-azabicyclo[3.2.1]octa-8-ol, 0,65 g de carbonato de potasio y 0,33 g de 2-cloro-5-cianopiridina. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con solución salina y se secó con sulfato de magnesio anhidro. Se obtuvieron 0,16 g de un compuesto crudo (A) evaporando los solventes bajo presión reducida y este compuesto se usó directamente en la etapa siguiente.

Etapa 2

Producción de 8β-[2-metoximetoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-3-(5-ciano-piridin-2-il)-3-azabicyclo[3.2.1]-octano (B)



Se agregaron 0,14 g de hidruro de sodio al 60% a 10 ml de una solución de DMF que contenía 0,58 g de 4-fluoro-3-hidroxibenzotrifluoruro con enfriamiento con hielo. Después de agitar la mezcla durante 30 minutos a temperatura ambiente, se agregaron 0,28 g de clorometil éter de a gotas a la misma enfriando con hielo. Después de completar la adición, la solución de reacción se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante 30 minutos y luego se calentó adicionalmente a 80°C y se agitó durante 30 minutos. Se agregaron 0,49 g del compuesto (A) y 0,13 g de hidruro de sodio al 60% a la mezcla de reacción a 80°C y la mezcla resultante se agitó durante 30 minutos y luego se calentó a 80°C y se agitó adicionalmente durante 2 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. Después de lavar con agua y secar con sulfato de magnesio anhidro, la capa orgánica se filtró y se evaporó bajo presión reducida. El concentrado se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: solvente mixto de n-hexano y acetato de etilo) para obtener 0,82 g del compuesto objetivo (B).

¹H-NMR (CDCl₃, δ ppm): 1,55-1,63 (m, 2H), 2,02-2,05 (m, 2H), 2,60 (brs, 2H), 3,13 (d, 2H), 3,52 (s, 3H), 4,22 (d, 2H), 4,63 (s, 1H), 5,20 (s, 2H), 6,58 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,37 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 8,41 (s, 1H).

Etapa 3

Producción de 8β-[2-hidroxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-3-(5-ciano-piridin-2-il)-3-azabicyclo[3.2.1]-octano (C)

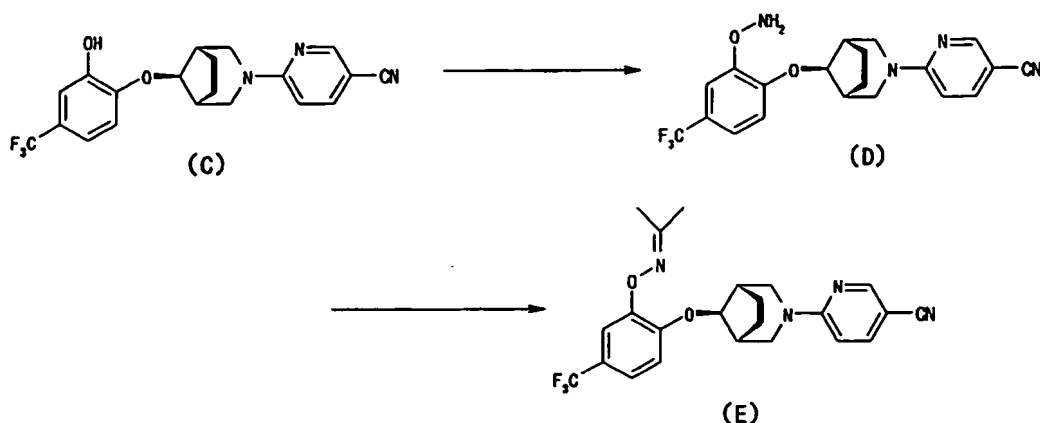


Se agregaron 10 ml de ácido clorhídrico al 10% a 10 ml de una solución de THF que contenía 0,82 g del compuesto (B) a temperatura ambiente. La mezcla se sometió a reflujo con calentamiento durante 30 minutos, se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con solución salina y se secó con sulfato de magnesio anhidro. Se obtuvieron 0,74 g del compuesto objetivo (C) evaporando los solventes bajo presión reducida. Este compuesto se usó directamente en la etapa siguiente sin purificación.

¹H-NMR (CDCl₃, δ ppm): 1,62-1,75 (m, 2H), 1,91-1,98 (m, 2H), 2,65 (brs, 2H), 3,17 (d, 2H), 4,26 (d, 2H), 4,66 (s, 1H), 5,63 (s, 1H), 6,60 (d, 1H), 6,98 (d, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,16 (s, 1H), 7,63 (d, 1H), 8,42 (s, 1H).

Etapa 4

Producción de 8β-[2-isopropilidenaminooxi-4-(trifluoro-metil)fenoxi]-3-(5-ciano-piridin-2-il)-3-azabicyclo[3.2.1]-octano (E)



Se sintetizaron 0,76 g de un compuesto (D) por el método descrito en la solicitud de patente japonesa publicada n^o. 2001-81071 usando 0,74 g del compuesto (C).

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃, δ ppm): 1,55-1,68 (m, 2H), 1,99-2,04 (m, 2H), 2,59 (brs, 2H), 3,13 (d, 2H), 4,22 (d, 2H), 4,60 (s, 1H), 6,00 (brs, 2H), 6,59 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,60 (d, 2H), 8,01 (s, 1H), 8,41 (s, 1H).

Se agregaron 3 ml de acetona y 1 gota de ácido clorhídrico concentrado a 3 ml de una solución de etanol que contenía 0,76 g del compuesto (D) y toda la mezcla se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. La mezcla se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. Después de lavar con agua y secar con sulfato de magnesio anhidro, la capa orgánica se filtró y se concentró al vacío. El concentrado se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: solvente mixto de n-hexano y acetato de etilo) para obtener 0,45 g del compuesto objetivo (E). Temperatura de fusión: 120-122°C.

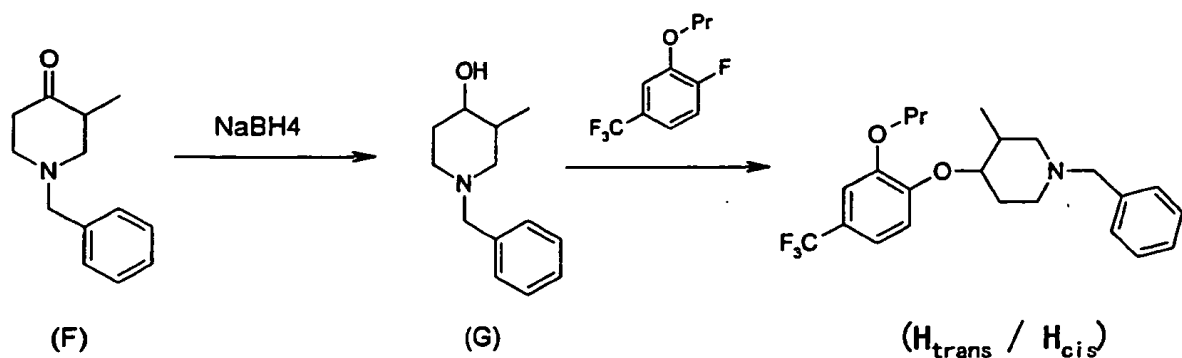
10

15 Ejemplo de producción 2

Producción de cis-3-metil-4-[2-propoxi-4-(trifluoro-metil)fenoxi]-1-[6-(trifluorometil)-piridazin-3-il]-piperidina y trans-3-metil-4-[2-propoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-1-[6-(trifluorometil)-piridazin-3-il]piperidina

20 Etapa 1

Producción de trans-1-bencil-3-metil-4-[2-propoxi-(4-trifluorometil)fenoxi]piperidina (H_{trans}) y cis-1-bencil-3-metil-4-[2-propoxi-(4-trifluorometil)fenoxi]piperidina (H_{cis})



25 Se agregaron 0,47 g de borohidruro de sodio a 40 ml de solución de etanol que contenía 2,53 g de N-bencil-3-metil-4-piperidinona (F) enfriando con hielo. La mezcla se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente y luego se neutralizó con ácido clorhídrico al 10% enfriando con hielo. La mezcla resultante se extrajo con cloruro de metileno y la capa orgánica se secó con sulfato de magnesio anhidro. Se obtuvieron 2,27 g de un compuesto (G) evaporando los solventes bajo presión reducida. Este compuesto se usó directamente en la siguiente reacción

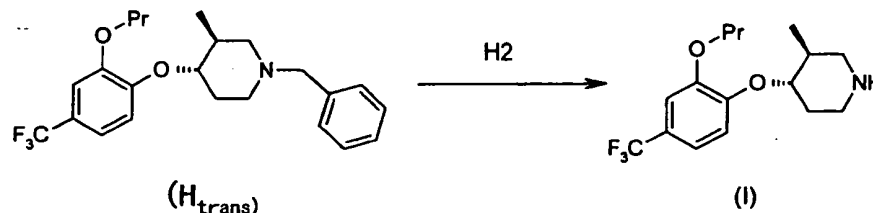
30

Se agregaron 0,66 g de 4-fluoro-3-propoxibenzotrifluoruro a 15 ml de DMF que contenía 1 g del compuesto crudo (G). La mezcla se calentó a 80°C y se agregaron 0,29 g de hidruro de sodio al 60% a la misma y la mezcla resultante se mantuvo calentada durante 5 horas a 100°C. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua y luego se extrajo con acetato de etilo. Después de lavar con agua y secar con sulfato de magnesio anhidro, la capa orgánica se filtró y se concentró al vacío. El concentrado se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: solvente mixto de n-hexano y acetato de etilo) para obtener 0,35 g de un isómero trans (H_{trans}) y 0,21 g de un isómero (H_{cis}) como primera y segunda fracciones, respectivamente.

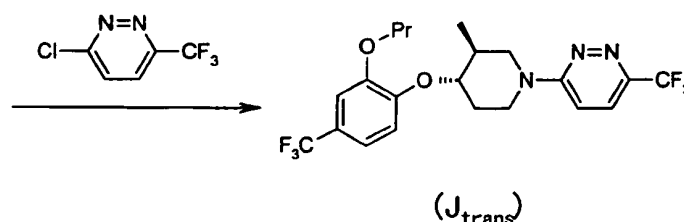
35

Etapa 2

Producción de cis-3-metil-4-[2-propoxi-4-(trifluorometil)-fenoxi]-1-[6-(trifluorometil)-piridazin-3-il]piperidina (J_{cis}) y trans-3-metil-4-[2-propoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-1-[6-(trifluorometil)-piridazin-3-il]piperidina (J_{trans})



5



Se agregó 0,1 g de hidróxido de paladio-carbono al 20% a 4 ml de solución de etanol que contenía 0,35 g del isómero trans (H_{trans}). Esta suspensión se calentó a 60°C y se agitó durante 1 día y 1 noche bajo atmósfera de hidrógeno (presión de hidrógeno: $1,01 \times 10^5$ Pa). Después de enfriar la mezcla a temperatura ambiente, se agregaron a la misma 8 ml de etanol y 0,1 g de hidróxido de paladio-carbono al 20%. Esta suspensión se calentó a 60°C y se agitó durante 9 horas bajo atmósfera de hidrógeno (presión de hidrógeno: $1,01 \times 10^5$ Pa). La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y luego se sometió a filtración en celite. Se obtuvieron 0,22 g de un compuesto crudo (I) evaporando el filtrado bajo presión reducida. Este compuesto se usó directamente en la reacción siguiente.

10

Se agregaron 0,14 g de 3-cloro-6-(trifluorometil)-piridazina, 0,28 g de carbonato de potasio, y 10 mg de yoduro de tetra-n-butilamonio a 2 ml de solución de acetonitrilo que contenía 0,22 g del compuesto crudo (I) y la mezcla se sometió a reflujo con calentamiento durante 1 hora a 120°C. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua, y luego se extrajo con acetato de etilo. Después de lavar con agua y secar con sulfato de magnesio anhidro se filtró la capa orgánica y se concentró al vacío. El concentrado se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: solvente mixto de n-hexano y acetato de etilo) para obtener 0,2 g del compuesto objetivo (J_{trans}).

20

Aceite viscoso.

Los datos de 1H -NMR de este compuesto son como sigue:

25

1H -NMR ($CDCl_3$, d ppm): 1,04 (t, 3H), 1,14 (d, 3H), 1,77-1,88 (m, 3H), 2,11-2,19 (m, 2H), 3,20 (dd, 1H), 3,45-3,54 (m, 1H), 3,98 (t, 2H), 4,16-4,31 (m, 3H), 6,97 (2 d, 2G x 2), 7,10 (s, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,46 (d, 1H).

Se obtuvieron 0,16 g del compuesto objetivo (J_{cis}) de 0,21 g del isómero cis (H_{cis}) por un procedimiento similar. Aceite viscoso.

30

Los datos de 1H -NMR de este compuesto son como sigue.

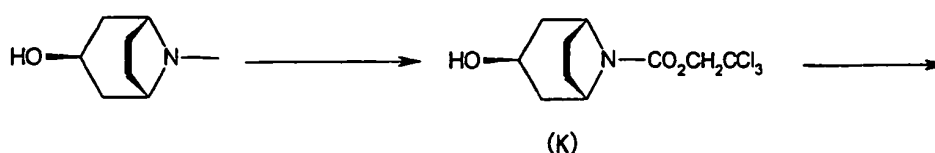
35

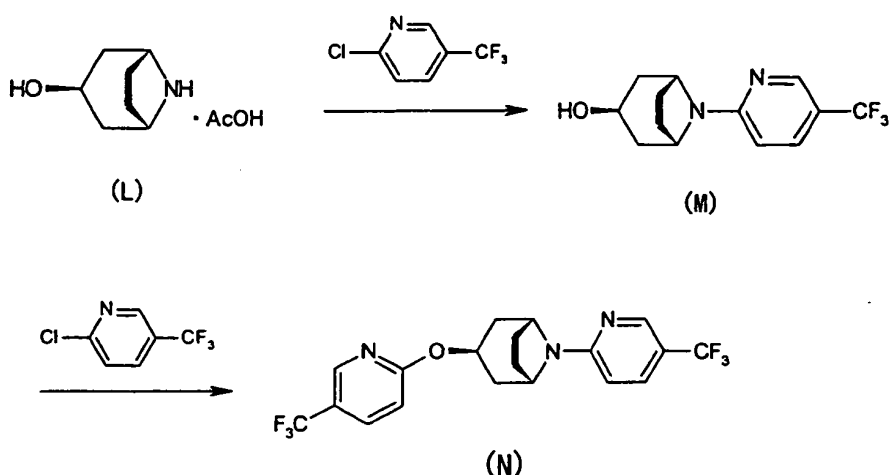
1H -NMR ($CDCl_3$, d ppm): 1,06 (t, 3H), 1,11 (d, 3H), 1,74-1,91 (m, 3H), 2,05-2,13 (m, 2H), 3,48 (dd, 1H), 3,57-3,66 (m, 1H), 3,98 (t, 2H), 4,09-4,19 (m, 2H), 4,56-4,58 (m, 1H), 6,97 (2 d, 1Hx2), 7,10 (s, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,46 (d, 1H).

Ejemplo de producción 3

Producción de 3 α -(5-trifluorometil-2-piridiloxi)-8-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-8-azabicyclo[3.2.1]octano (N).

40





Se agregaron 23,3 g de 2,2,2-tricloroetil cloroformato éster a 150 ml de la suspensión de benceno que contenía 14,1 g de tropina y 1,4 g de carbonato de potasio a temperatura ambiente y toda la mezcla se sometió a reflujo durante 3,5 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con solución salina y se secó con sulfato de magnesio anhidro. Se obtuvieron 30,1 g de un carbonato oleoso (K) evaporando los solventes bajo presión reducida y este carbonato se usó directamente en la siguiente reacción.

A continuación, se agregaron 65 g de polvo de cinc a 250 ml de la solución de acetato de este carbonato (K). Después de agitar durante 5 minutos, la mezcla se calentó a 80°C durante 1 hora. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se sometió a filtración en celite. Se obtuvieron 15,5 g de un producto crudo del compuesto (L) concentrando al vacío el filtrado.

Se sometieron a reflujo durante 3,5 horas 150 ml de una suspensión de acetonitrilo que contenía 5,64 g del producto crudo del compuesto (L) obtenido como se indicó anteriormente, 41,5 g de carbonato de potasio y 8,2 g de 2-cloro-5-trifluorometilpiridina. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con solución salina y se secó con sulfato de magnesio anhidro. Se obtuvieron 3,5 g del compuesto (M) como cristales evaporando los solventes bajo presión reducida.

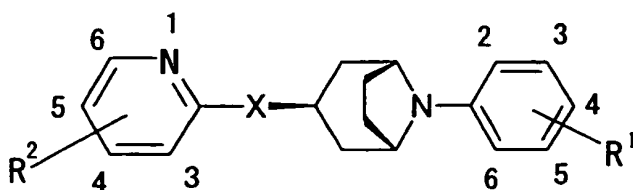
¹H-NMR (CDCl₃, δ ppm): 1,42 (d, 1H), 1,77 (d, 2H), 2,05-2,20 (m, 4H), 2,32-2,39 (m, 2H), 4,09 (brs, 1H), 4,53 (brs, 2H), 6,52 (d, 1H), 7,58 (dd, 1H), 8,38 (d, 1H).

Se agregaron 32 mg de hidruro de sodio al 60% a 3 ml de una solución de DMF que contenía 0,21 g del compuesto (M) enfriando con hielo y toda la mezcla se agitó durante 40 minutos. A continuación, se agregaron 0,17 g de 2-cloro-5-trifluorometilpiridina a esta mezcla y la mezcla resultante se calentó a 100°C y se agitó durante la noche con calentamiento. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vertió en agua helada y se extrajo con acetato de etilo. Después de lavar con agua y secar con sulfato de magnesio anhidro, la capa orgánica se filtró y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna (eluyente: solvente mixto de n-hexano y acetato de etilo) para obtener el compuesto objetivo (N). Temperatura de fusión: 104-105°C.

¹H-NMR (CDCl₃, δ ppm): 1,25 (s, 1H), 1,55 (s, 1H), 1,95-2,33 (m, 6H), 4,58 (brs, 2H), 5,37 (t, 1H), 6,55 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 7,61 (dd, 1H), 7,78 (dd, 1H), 8,41 (s, 2H).

Los ejemplos de los compuestos de la presente invención producidos por el método de acuerdo con los ejemplos anteriormente mencionados se muestran en la tabla a continuación incluyendo los compuestos producidos en los ejemplos indicados anteriormente. Debe apreciarse que en la tabla a continuación, R¹ y R² muestran sustituyentes, incluyendo sustituyentes asociados por dos o más sustituyentes de modo que se simplifica la tabla. Además, la descripción "vis" muestra que el compuesto es un aceite viscoso y la descripción "amor" muestra que el compuesto es amorfo. Además, nD_{21,8}-1,5008 significa que el índice de refracción a 21,8°C es 1,5008 (lo mismo también se aplica a otros). Además, la descripción "cPr" significa ciclopropilo, la descripción "cHex" significa ciclohexilo (lo mismo se aplica a otros), la descripción "Ac" significa acetilo, la descripción "nPr" significa propilo normal, la descripción "iPr" significa isopropilo, la descripción "nBu" significa butilo normal, la descripción "iBu" significa isobutilo y la descripción "tBu" significa butilo terciario, y la descripción "TMS" significa trimetilsililo y la descripción "THF" significa tetrahidrofurano.

[Tablas 1-3]



Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C
1-1	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	[90-92]
1-2	5-CF ₃	O	2-CHO-4-CF ₃	[122-123]
1-3	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	vis
1-4	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OCH(OMe)Me-4-CF ₃	[82-85]
1-5	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	vis
1-6	5-CF ₃	O	2-Cl-4-CF ₃	[92-93]
1-7	5-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	vis
1-8	5-CF ₃	O	2,6-(NO ₂) ₂ -4-CF ₃	vis
1-9	5-CF ₃	O	2-C(O)NHCH(Me)CH ₂ OH-4-CF ₃	amor
1-10	5-CF ₃	O	2-CH=NOEt-4-CF ₃	vis
1-11	5-CF ₃	O	(E)-2-CH=NOiPr-4-CF ₃	[79-80]
1-12	5-CF ₃	O	2-CH=NO-propargil-4-CF ₃	[84-86]
1-13	5-CF ₃	O	2-(5-Me-oxazolin-2-yl)-4-CF ₃	vis
1-14	3-Cl-5-CF ₃	O	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	vis
1-15	5-CF ₃	O	2-OMe-4-CF ₃	[127-130]
1-16	5-CF ₃	O	(Z)-2-CH=NOiPr-4-CF ₃	vis
1-17	5-CF ₃	O	2-C(O)OEt-4-CF ₃	vis
1-18	5-CF ₃	O	2-C(O)OtBu-4-CF ₃	[95-98]
1-19	3-Cl-5-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	vis
1-20	5-CF ₃	O	6-Cl-2-C(O)OiPr-4-CF ₃	vis
1-21	5-CF ₃	O	2-CH=NOMe-4-CF ₃	vis
1-22	5-CF ₃	O	2-CH=NOMe-4-CF ₃	vis
1-23	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH ₂ cPr-4-CF ₃	vis
1-24	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH ₂ CF ₃ -4-CF ₃	vis
1-25	5-CF ₃	O	2-C(O)OiBu-4-CF ₃	vis
1-26	5-CF ₃	O	2-C(O)OnPr-4-CF ₃	vis

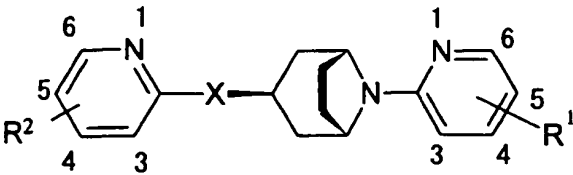
ES 2 375 639 T3

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
1-27	5-CF ₃	O	2-CH(OH)CH ₂ CH(Me) ₂ -4-CF ₃	amor
1-28	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH(Me)CH=CH ₂ -4-CF ₃	vis
1-29	5-CF ₃	O	2-C(O)OcPen-4-CF ₃	vis
1-30	5-CF ₃	O	2-C(O)ON=C(Me) ₂ -4-CF ₃	vis
1-31	5-CF ₃	O	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	[88-90]
1-32	5-CF ₃	O	2-OEt-4-CF ₃	[102-105]
1-33	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH ₂ CHF ₂ -4-CF ₃	vis
1-34	5-CF ₃	O	2-OnBu-4-CF ₃	[90-92]
1-35	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CN	[107-110]
1-36	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH ₂ OMe-4-CF ₃	vis
1-37	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH ₂ tBu-4-CF ₃	[100-102]
1-38	5-CF ₃	O	2-C(O)N(Me) ₂ -4-CF ₃	vis
1-39	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH(Me)CH(Me) ₂ -4-CF ₃	vis
1-40	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH(Et) ₂ -4-CF ₃	vis
1-41	5-CF ₃	O	2-C(O)O(THF-3-yl)-4-CF ₃	vis
1-42	5-CF ₃	NH	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	vis
1-43	5-CF ₃	O	2-C(O)O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	vis
1-44	5-C-F ₃	O	2-C(O)OCH(Me)CH ₂ OMe-4-CF ₃	vis
1-45	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH(CN)Me-4-CF ₃	vis
1-46	5-CF ₃	O	2-C(O)OCH(Cl)Et-4-CF ₃	vis
1-47	5-CF ₃	O	2-C(O)SiPr-4-CF ₃	vis
1-48	5-CF ₃	O	2-OBn-4-CF ₃	[98-102]
1-49	5-CF ₃	O	2-OH-4-CF ₃	[130-131]
1-50	5-CF ₃	O	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	[116-120]
1-51	5-CN	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	[124-126]
1-52	5-CF ₃	O	2-CH(OTMS)CH ₂ CN-4-CF ₃	[131-133]
1-53	5-CF ₃	O	2-CH(OH)CH ₂ CN-4-CF ₃	[24-25]
1-54	5-CN	O	2-OnPr-4-CF ₃	[141-142]
1-55	5-CF ₃	O	2-OCH ₂ cPr-4-C ₃ F ₇	nD _{22.2} -1.4942
1-56	3-Me	O	4-Ph	

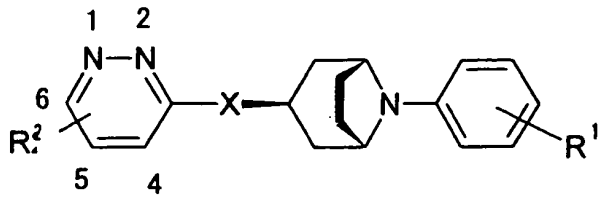
ES 2 375 639 T3

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
1-57	3-F	O	3,4,5,6-F4	
1-58	5-CN	S	2-CN	
1-59	5-NO ₂	S	3-CF ₃	
1-60	5-CHO	S	4-iPr	
1-61	4-OMe	S	3,5-Me ₂	
1-62	4-cPr	S	3-NO ₂	
1-63	5-OcHex	SO ₂	3-Br	
1-64	3-CH ₂ CH ₂ cPr	SO ₂	3-cPr	
1-65	4-OCH ₂ cPr	SO ₂	4-OcPr	
1-66	4-OCH=CH ₂	SO ₂	2-CH ₂ cPr	
1-67	5-OCF ₃	SO ₂	2-OCH ₂ cPr	
1-68	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	NH	4-OCH=CH ₂	
1-69	4-CO ₂ Et	NH	2-OCH ₂ Cl	
1-70	6-F	NH	2-OCH=CB _{r2}	
1-71	6-CN	NMe	3-NO ₂	
1-72	6-NO ₂	NAc	4-OCF ₃	
1-73	6-OcPr	NMe	4-CN	

[Tabla 4]

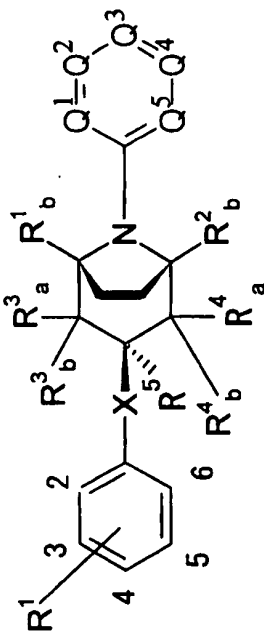
				
Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física [] : Punto de fusión °C
2-1	5-CF ₃	O	4-CF ₃ -6-Cl	nD _{22.1} -1.5134
2-2	4-CF ₃ -6-Cl	O	5-CF ₃	vis
2-3	5-CF ₃	O	5-CF ₃	[104-105]
2-4	5-CF ₃ -6-OnPr	O	5-CF ₃	[90-93]
2-5	5-CF ₃	S	4-cPr	
2-6	3-Me	S	3-OcPr	
2-7	3-F	S	3,5-Me ₂	
2-8	5-CN	S	4-CF ₃	
2-9	5-NO ₂	SO ₂	5-CO ₂ Et	
2-10	5-CHO	SO ₂	4-CH=CF ₂	
2-11	4-OMe	SO ₂	5-CH=Cme ₂	
2-12	4-cPr	SO ₂	3-OCH ₂ CH ₂ cPr	
2-13	5-OcHex	NH	4-CH ₂ cPr	
2-14	3-CH ₂ CH ₂ cPr	NH	3-Oet-4-cPr	
2-15	4-OCH ₂ cPr	Nme	4-CHO	
2-16	6-Me	Nme	5-NO ₂	

[Tabla 5]

				
Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C
3-1	6-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	[154-157]
3-2	6-CF ₃	O	2-CH ₂ OEt-5-CF ₃	nD22.2-1.4996
3-3	4-CF ₃	O	2-Me	
3-4	5-CF ₃	O	3-Cl	
3-5	4-Br	S	4-CF ₃	
3-6	5-Me	S	3-NO ₂	
3-7	6-CF ₃	S	3-CO ₂ Me	
3-8	6-CF ₃	SO ₂	4-tBu	
3-9	4-cPr	SO ₂	3-cPr	
3-10	6-CF ₃	NH	4-OcHex	
3-11	6-OCH ₂ CH ₂ cPr	NH	4-Nme ₂	
3-12	5-CH=Cme ₂	NH	3-iPr	
3-13	6-CF ₃	Nme	4-OCF ₃	
3-14	4-NO ₂	Nme	2-CN	
3-15	5-CHO	Nac	4-CHO	

[Tablas 6-9]

Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique de otra manera									
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física [°]: Punto de fusión °C	Observación
4-1	2-OnPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[197-199]	
4-2	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-Me	CH	N	O	[175-176]	
4-3	2-OnPr-4-CF3	N	C-Cl	N	CH	C-Me	O	[128-132]	
4-4	2-OnPr-4-CF3	N	C-Cl	C-Me	CH	N	O	[83-89]	
4-5	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	N	O	[152-155]	
4-6	2-OnPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	amor	R3 ^b =R4 ^b b=Me
4-7	2-OCH2CH(Me)OMe-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[181-185]	
4-8	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CN	CH	CH	O	[213-215]	
4-9	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[204-206]	
4-10	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CN	CH	CH	O	[219-221]	
4-11	2-OnBu-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[197-199]	
4-12	2-OiBu-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[223-224]	
4-13	2-Oet-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[192-194]	
4-14	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[201-203]	



(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
4-15	2-OCH ₂ CH(F)Me-4-CF ₃	N	N	C-CN	CH	CH	O	[215-218]	
4-16	2-OCH ₂ CH(F)Me-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[197-200]	
4-17	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	CH	N	C-Cl	CH	CH	O	[148-150]	
4-18	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	CH	N	C-CN	CH	CH	O	[126-128]	
4-19	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[214-216]	sulfato
4-20	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[220up]	borato
4-21	4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[187-188]	
4-22	2-OnPr-4-CF ₃	CH	N	C-Cl	CH	CH	O	[149-150]	
4-23	4-CF ₃	C-OnPr	N	C-CF ₃	CH	CH	O	nD _{21,9} -1,5132	
4-24	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	vis	
4-25	4-CF ₃	CH	CH	N	CH	CH	O		
4-26	2,6-Me ₂	CH	Cme	N	CBr	CH	O		
4-27	4-Ome	N	N	Cme	CH	CH	S		
4-28	3-NO ₂	N	N	C-CF ₃	CH	CH	S		
4-29	2-F	N	N	C-CF ₃	CH	CH	S		
4-30	3-CHO	N	N	C-CN	CH	CH	S		
4-31	3-OiPr	N	N	C-CF ₃	CH	CH	S		
4-32	4-Me	CH	N	C-Cl	CH	CH	S		
4-33	4-cPr	CH	N	C-CN	CH	CH	S		
4-34	3-OcPr	N	N	C-CF ₃	CH	CH	S		
4-35	4-CH ₂ cPr	N	N	C-CF ₃	CH	CH	SO ₂		
4-36	2-OCH ₂ CH ₂ cPr	N	N	C-CF ₃	CH	CH	SO ₂		

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
4-37	3-OCH=Cme2	N	N	C-CF3	CH	CH	SO2		
4-38	4-OCF3	N	N	C-CF3	CH	CH	SO2		
4-39	4-OCF3	N	N	C-CN	CH	CH	SO2		
4-40	3-CO2Me	N	N	C-CF3	CH	CH	SO2		
4-41	3-Me	CH	N	C-Cl	CH	CH	NH		
4-42	4-tBu	CH	N	C-CN	CH	CH	NH		
4-43	2-CH=CHMe	N	N	C-CF3	CH	CH	NH		
4-44	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	NH		
4-45	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	NH		
4-46	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CN	CH	CH	NH		
4-47	2-OnBu-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	Nme		
4-48	2-OiHu-4-CF3	CH	N	C-Cl	CH	CH	Net		
4-49	2-Oet-4-CF3	CH	N	C-CN	CH	CH	Nac		
4-50	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	Nac		
4-51	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[124-125]	
4-52	2-OCH2cPr4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[129-131]	
4-53	2-OCH2CHFMe-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[105-109]	
4-54	2-OCH2CH2Ome-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	nD24.7 -1.5697	
4-55	2-CO2iPr-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[133-135]	
4-56	2-OCH2iPr-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[139-141]	

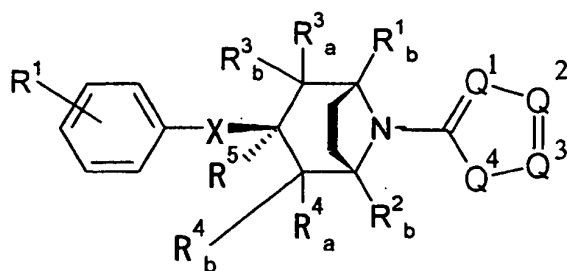
(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física [·]: Punto de fusión °C	Observación
4-57	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[90-93]	
4-58	2-OCH ₂ CH(Me)Ome-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[114-118]	
4-59	2-ON=C(Me) ₂ -4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[125-128]	
4-60	2-OnPr-4-OCF ₃	N	CH	C-CF ₃	CH	CH	NH	[89-90]	
4-61	2-Ome-4-OCF ₃	N	CH	C-CF ₃	CH	CH	NH	[114-116]	
4-62	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-CF ₃	CH	CH	NH	[96-97]	
4-63	2-Me-3-CF ₃	N	CH	C-CF ₃	CH	CH	NH	[124-125]	
4-64	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	C-CF ₃	CH	CH	O	vis	
4-65	2-OnPr-4-CF ₃	C-Cl	CH	C-CF ₃	CH	CH	O	[104-105]	
4-66	2-OnPr-4-CF ₃	C-NO ₂	CH	C-CF ₃	CH	CH	O	vis	
4-67	2-OnPr-4-CF ₃	C-F	CH	C-CF ₃	CH	CH	O	vis	
4-68	2-OnPr-4-CF ₃	c-N(SO ₂ Me) ₂	CH	C-CF ₃	CH	CH	O	amor	
4-69	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	C-Ome	CH	CH	O	[119-120]	
4-70	2-OnPr-4-CF ₃	CH	C-F	C-CF ₃	CH	CH	O	vis	
4-71	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	C-OCF ₃	CH	CH	O	vis	
4-72	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	C-NO ₂	CH	CH	O	[114-117]	
4-73	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	CH ₂	CH	CH	O	vis	
4-74	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	C-NHS O ₂ CF ₃	CH	CH	O	[90-95]	
4-75	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	C-Br	CH	CH	O	vis	
4-76	2-OnPr-4-CF ₃	CH	C-Cl	C-Cl	CH	CH	O	vis	

(continuación)

Compuesto n°	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física [·]: Punto de fusión °C	Observación
4-77	2-OnPr-4-CF3	CH	CH	C-tBu	CH	CH	O	[139-141]	
4-78	2-OnPr-4-CF3	CH	CH	C-Ph	CH	CH	O	[40-50]	
4-79	2-OnPr-4-CF3	CH	C-Oet	C-CF3	CH	CH	O	vis	
4-80	2-OnPr-4-CF3	CH	C-nPr	C-CF3	CH	CH	O	nD20.4 -1.4827	
4-81	2-OnPr-4-CF3	CH	C-C=NOEt	C-CF3	CH	CH	O	[103-105]	
4-82	2-OnPr-4-CF3	CH	C-CO2iPr	C-CF3	CH	CH	O	vis	

[Tablas 10-11]



Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario.

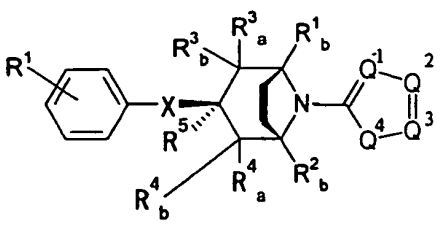
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C
5-1	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[93-95]
5-2	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[110-112]
5-3	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[112-114]
5-4	2-ON=C (Me) ₂ -4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[121-124]
5-5	2-OiBu-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[147-150]
5-6	2-OCH ₂ C (Me)=CH ₂ -4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[121-124]
5-7	2-OCH ₂ CH (Me)OMe-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[98-102]
5-8	2-OCH ₂ CH (F)Me-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[105-108]
5-9	2-OnPr-4-CF ₃	C-CN	C-CF ₃	N	N-Me	O	[91-92]
5-10	2-OnPr-4-CF ₃	C-C(O)NH ₂	C-CF ₃	N	N-Me	O	[180-181]
5-11	4-CF ₃	CH	CH	CH	O	S	
5-12	2-CF ₃ -3-Cl	N	CH	Cme	O	S	
5-13	4-CF ₃	CH	N	CH	O	S	
5-14	4-CF ₃ -2-OnPr	N	N	CH	O	S	
5-15	3-CF ₃	N	N	CH	O	S	
5-16	3-Me	O	CH	CH	NH	SO ₂	
5-17	3-F	CH	CH	CH	NH	SO ₂	

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C
5-18	2-CN	CH	O	CH	NH	SO ₂	
5-19	3-NO ₂	N	CH	C-CF ₃	NH	SO ₂	
5-20	4-CHO	N	CH	CH	NH	SO ₂	
5-21	4-Ome	CH	CH	CH	S	SO ₂	
5-22	4-cPr	N	CH	CH	S	SO ₂	
5-23	2-OcHex	N	CH	CH	S	NH	
5-24	3-CH ₂ CH ₂ cPr	N	CH	CH	S	NH	
5-25	4-OCH ₂ cPr	N	CH	CH	S	NH	
5-26	2-CHO	N	CH	CH	O	NH	
5-27	3-OCH=CHMe	N	Cme	CH	O	Nme	
5-28	2-CO ₂ Et	CH	CH	CH	O	Nme	

5

[Tabla 12]

							
Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario.							
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C
6-1	2-OnPr-4-CF ₃	N	NH	C-CF ₃	C	O	vis
6-2	2-OnPr-4-CF ₃	N	NMe	C-CF ₃	S	O	
6-3	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	N	NH	C-CF ₃	S	O	
6-4	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	N	NH	C-CF ₃	S	S	
6-5	2-ON=C (Me) ₂ -4-CF ₃	N	NH	C-CF ₃	S	S	

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C
6-6	2-OiBu-4-CF ₃	N	Net	C-CF ₃	S	SO ₂	
6-7	2-OCH ₂ C (Me)=CH ₂ -4- CF ₃	N	ac	C-CF ₃	S	Nac	
6-8	2-OCH ₂ CH (Me)Ome-4- CF ₃	N	NH	C-CF ₃	S	NH	
6-9	2-OCH ₂ CH (F)Me-4-CF ₃	N	NH	C-CF ₃	S	NH	
6-10	2-OnPr-4-CF ₃	C-CN	CH-CF ₃	N	N-Me	O	
6-11	2-OnPr-4-CF ₃	C-C(O)NH ₂	Cme ₂	N	N-Me	O	

[Tablas 13-14]

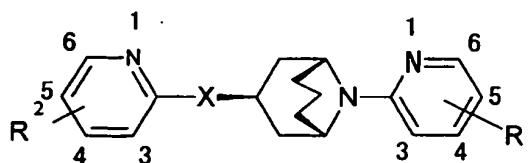
Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C
7-1	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	amor
7-2	5-CF ₃	O	2-CHO-4-CF ₃	nD22.2-1.5330
7-3	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	nD22.3-1.5194
7-4	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OEt-4- CF ₃	nD22.3-1.5003
7-5	3-Me	O	2-OnPr-4-CF ₃	
7-6	4-Ph	O	4-CF ₃	
7-7	3-OnPr	O	2-CF ₃ -3-Cl	
7-8	3-OCH ₂ cPr	O	4-CF ₃	
7-9	4-tBu	O	4-CF ₃ -2-OnPr	
7-10	4-OCH ₂ CHFMe	O	3-CF ₃	
7-11	-	S	3-Me	
7-12	3-Br	S	3-F	
7-13	4-CO ₂ tBu	S	2-CN	
7-14	3-CO ₂ Et	S	3-NO ₂	
7-15	2-OCF=CH ₂	S	4-CHO	

(continuación)

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
7-16	5-OCH=CHMe	S	4-Ome	
7-17	3-OCH2cPr	SO2	4-cPr	
7-18	4-CH2CH2cPr	SO2	2-OcHex	
7-19	3-OcPr	SO2	3-CH2CH2cPr	
7-20	4-cPr	NH	4-OCH2cPr	
7-21	5-OCF3	NH	2-OnPr-4-CF3	
7-22	3,5-Me2	NH	4-CF3	
7-23	6-Cl	NH	2-CF3-3-Cl	
7-24	5-NO2	Nme	4-CF3	
7-25	4-CHO	Nac	4-CF3-2-OnPr	

[Tablas 15-16]

5



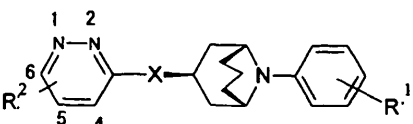
Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
8-1	5-CF3	O	5-CF3	nD22.7-1.5174
8-2	5-CF3	O	3-Cl-5-CF3	nD23.0-1.5266
8-3	3-Me	O	5-CF3	
8-4	3-F	O	4-cPr	
8-5	5-CN	S	3-OcPr	
8-6	5-NO2	S	3,5-Me2	
8-7	5-CHO	S	4-CF3	
8-8	4-OMe	S	5-CO2Et	
8-9	4-cPr	S	4-CH=CF2	
8-10	5-OcHex	SO2	5-CH=Cme2	
8-11	3-CH2CH2cPr	SO2	3-OCH2CH2cPr	
8-12	4-OCH2cPr	SO2	4-CH2cPr	
8-13	4-OCH=CH2	SO2	3-Oet-4-cPr	
8-14	5-OCF3	SO2	4-CHO	
8-15	4-OCH=CHCH2CF3	NH	5-NO2	
8-16	4-CO2Et	NH	5-CF3	
8-17	6-F	NH	4-cPr	

(continuación)

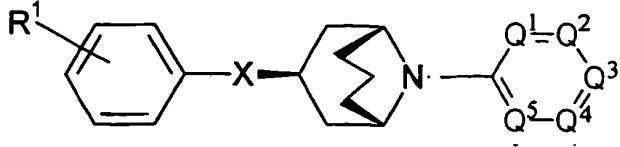
Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
8-18	6-CN	Nme	4-CO ₂ Et	
8-19	6-NO ₂	Nac	3-Me	
8-20	6-OcPr	Nme	5-OCF ₃	
8-21	3-Me	O	4-Ome	
8-22	3-F	O	5-Cl	
8-23	4-OCH=CF ₂	S	3-nBu	

[Tablas 17-18]

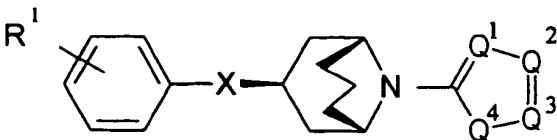
5

				
Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
9-1	6-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	vis
9-2	6-CF ₃	O	4-CF ₃	nD _{22.3} -1.5245
9-3	5-Me	O	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	
9-4	6-CF ₃	O	2-Cl-4-CF ₃	
9-5	6-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	
9-6	4-cPr	O	2,6-(NO ₂) ₂ -4-CF ₃	
9-7	6-CF ₃	S	2-C(O)NHCH(Me)CH ₂ OH-4-CF ₃	
9-8	6-OCH ₂ CH ₂ cPr	S	2-CH=NOEt-4-CF ₃	
9-9	5-OCH=Cme ₂	S	(E)-2-CH=NoiPr-4-CF ₃	
9-10	6-CF ₃	S	2-CH=NO-propargyl-4-CF ₃	
9-11	4-NO ₂	S	2-(5-Me-oxazolin-2-yl)-4-CF ₃	
9-12	5-CHO	S	2-CH ₂ Oet-4-CF ₃	
9-13	5-Me	SO ₂	2-Ome-4-CF ₃	
9-14	6-CF ₃	SO ₂	(Z)-2-CH=NoiPr-4-CF ₃	
9-15	6-CF ₃	SO ₂	2-C(O)Oet-4-CF ₃	
9-16	4-CN	SO ₂	2-C(O)OtBu-4-CF ₃	
9-17	5-Br	NH	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	
9-18	4-OcPr	NH	6-Cl-2-C(O)OiPr-4-CF ₃	
9-19	5-OtBu	NH	3-Br	
9-20	5-OCH=CHMe	NH	4-Me	
9-21	4-OCH=CHF	Nme	-	
9-22	6-CO ₂ Me	Nac	2-Cl	

[Tablas 19-20]

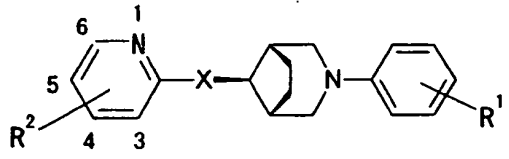
								
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C
10-1	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[116-117]
10-2	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[112-113]
10-3	2-OiBu-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[148-149]
10-4	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	nD22.1-1.5088
10-5	4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[130-131]
10-6	2-OCH ₂ CH(F)Me-4-CF ₃	N	CH	CH	N	C-Me	O	
10-7	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	CH	N	CH	O	
10-8	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-CF ₃	N	CH	S	
10-9	4-CF ₃	N	C-Br	CH	N	CH	S	
10-10	2-CF ₃ -3-Cl	N	CH	CH	CH	N	S	
10-11	4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	S	
10-12	4-CF ₃ -2-OnPr	N	C-CN	CH	CH	CH	S	
10-13	3-CF ₃	N	CH	N	C-CF ₃	C-CF ₃	S	
10-14	3-Me	CH	N	C-CN	CH	CH	S	
10-15	3-F	N	CH	CH	CH	N	SO ₂	
10-16	2-CN	C-Me	N	CH	CH	CH	SO ₂	
10-17	3-NO ₂	N	C-F	CH	CH	N	NH	
10-18	4-CHO	N	C-Cl	CH	CH	N	NH	
10-19	4-Ome	N	CH	N	CH	CH	NH	
10-20	4-cPr	CH	C-Me	N	C-Me	CH	NiPr	
10-21	2-OcHex	CH	CH	N	CH	CH	Nme	
10-22	3-CH ₂ CH ₂ cPr	CH	CH	N	CH	CH	Nme	

[Tabla 21]

								
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
11-1	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	vis	
11-2	3-F	CH	CH	CH	S	O		
11-3	2-CN	CH	CH	CH	O	O		
11-4	3-NO ₂	N	CH	C-Me -	S	S		
11-5	4-CHO	N	C-F	CH	O	S		
11-6	4-OMe	N	N	CH	NH	S		
11-7	4-cPr	N	CH	CH	S	SO ₂		
11-8	2-OcHex	N	CH	CH	Nme	SO ₂		
11-9	3-CH ₂ CH ₂ cPr	N	N	CH	S	NH		
11-10	4-OCH ₂ cPr	N	CH	CH	NH	NH		
11-11	2-CHO	CH	N	CH	NH	Nme		

[Tabla 22]

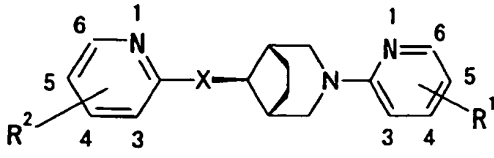
5

				
Compuesto nº	Q	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
12-1	5-CF ₃	O	2-NO ₂ -4-CF ₃	[92-94]
12-2	5-CF ₃	O	2-NH ₂ -4-CF ₃	[120-122]
12-3	5-CF ₃	O	2-NHAc-4-CF ₃	[145-147]
12-4	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	[104-106]
12-5	5-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	nD _{21.8} -1.5008
12-6	3-Cl	O	2-CH=NOEt-4-CF ₃	
12-7	4-CHO	O	(E)-2-CH=NOiPr-4-CF ₃	
12-8	6-NO ₂	S	2-CH=NO-propargil-4-CF ₃	
12-9	4-OCH=CH ₂	S	2-(5-Me-oxazolin-2-yl)-4-CF ₃	
12-10	5-OCF ₃	S	2-CH ₂ Oet-4-CF ₃	

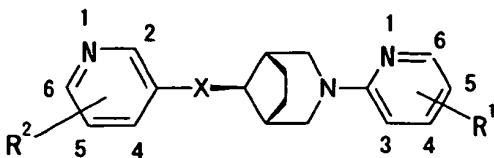
(continuación)

Compuesto nº	Q	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
12-11	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	S	2-Ome-4-CF ₃	
12-12	4-CO ₂ Et	S	(Z)-2-CH=N <i>oiPr</i> -4-CF ₃	
12-13	6-OCF ₃	SO ₂	2-C(O) <i>Oet</i> -4-CF ₃	
12-14	6-CN	SO ₂	2-C(O) <i>OtBu</i> -4-CF ₃	
12-15	6-NO ₂	SO ₂	2-C(O) <i>OiPr</i> -4-CF ₃	
12-16	6- <i>OcPr</i>	NH	6-Cl-2-C(O) <i>OiPr</i> -4-CF ₃	
12-17	3-Me	NH	3-Br	
12-18	3-F	Net	4- <i>cPr</i>	

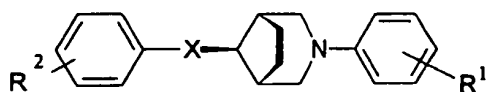
[Tabla 23]

				
Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C
13-1	5-CF ₃	O	5-CF ₃	[79-81]
13-2	6- <i>OnPr</i> -5-CF ₃	O	5-CF ₃	[70-72]
13-3	6-Cl-5-CF ₃	O	5-CF ₃	[100-102]
13-4	4-NO ₂	O	4- <i>cPr</i>	
13-5	3-CO ₂ <i>iPr</i>	O	3- <i>OcPr</i>	
13-6	4-OCH=CHF	S	3,5-Me ₂	
13-7	3-CH=CH ₂	S	4-CF ₃	
13-8	4-OCH ₂ <i>cPr</i>	S	5-CO ₂ Et	
13-9	5-CH ₂ <i>cPr</i>	S	4-CH=CF ₂	
13-10	3- <i>OcPr</i>	S	S-CH=CMe ₂	
13-11	4- <i>cPr</i>	SO ₂	3-OCH ₂ CH ₂ <i>cPr</i>	
13-12	4-OCHF ₂	NH	4-CH ₂ <i>cPr</i>	
13-13	3-Ome	NH	3- <i>Oet</i> -4- <i>cPr</i>	
13-14	4-CN	NH	4-CHO	
13-15	3-CHO	NH	5-NO ₂	
13-16	5-NO ₂	Nme	5-CF ₃	
13-17	4-F	Nac	4- <i>cPr</i>	
13-18	3,5-Me ₂	Nac	4-CO ₂ Et	

[Tabla 24]

				
Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C
14-1	2-OiBu-6-CF ₃	O	5-CF ₃	nD22.5 -1.5074
14-2	5-CF ₃ -6-OnPr	O	5-CF ₃	[70-72]
14-3	5-CHO	O	5-CF ₃	
14-4	4-OMe	O	4-cPr	
14-5	4-cPr	S	3-OcPr	
14-6	5-OcHex	S	3,5-Me ₂	
14-7	4-CH ₂ CH ₂ cPr	S	4-CF ₃	
14-8	4-OCH ₂ cPr	S	5-CO ₂ Et	
14-9	4-OCH=CH ₂	S	4-CH=CF ₂	
14-10	5-OCF ₃	SO ₂	5-CH=Cme ₂	
14-11	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	SO	3-OCH ₂ CH ₂ cPr	
14-12	4-CO ₂ Et	SO	4-CH ₂ cPr	
14-13	6-F	NH	3-Oet-4-cPr	
14-14	6-CN	NH	4-CHO	
14-15	6-NO ₂	NH	4-Ome	
14-16	6-OcPr	Nme	3-F	
14-17	2-Me	Nac	4-CO ₂ Me	
14-18	2-F	Nac	5-CH ₂ CH ₂ cPr	

[Tabla 25]



Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C
15-1	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	O	4-CF ₃	vis
15-2	2-OCH ₂ CH(F)Me-4-CF ₃	O	2-F	
15-3	2-OnPr-4-CF ₃	O	3,4-Me ₂	
15-4	2-OnPr-4-CF ₃	S	3-OMe	
15-5	4-CF ₃	S	3-CHO	
15-6	2-CF ₃ -3-Cl	S	4-NO ₂	
15-7	4-CF ₃	SO	2-CO ₂ Et	
15-8	4-CF ₃ -2-OnPr	SO	3-CH=CHEt	
15-9	3-CF ₃	SO	4-OCH=CHMe	
15-10	3-Me	SO ₂	3-OCF ₃	
15-11	3-F	SO ₂	4-OCH=CF ₂	
15-12	2-CN	NH	2-CF ₃ -3-Cl	
15-13	3-NO ₂	NH	4-CF ₃	
15-14	2-CH=Cme ₂	NH	4-CF ₃ -2-OnPr	
15-15	3-OCH=CF ₂	Nac	3-CF ₃	
15-16	4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ cPr	Nme	3-Me	
15-17	2-OcPr-4-CF ₃	O	4-CF ₃	vis

[Tablas 26-29]

Compuesto nº	R1	cis					trans					Observación
		Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física [°C]: Punto de fusión °C				
16-1	2-OnPr-4-CF3	CH	N	C-CF3	CH	CH	O	[79-80]	cis			
16-2	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	N	CH	O	vis	cis			
16-3	2-OnPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[100-103]	cis			
16-4	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	vis	cis			
16-5	2-CH2OEt-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[99-102]	cis			
16-6	2-OCH2CH(Me)Ome-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[103-105]	cis			
16-7	2-OnPr-4-CF3	N	N	C-Cl	CH	CH	O	[103-105]	cis			
16-8	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CN	CH	CH	O	[106-108]	cis			
16-9	2-OCH2CH(Me)Ome-4-CF3	N	N	C-CN	CH	CH	O	[130-131]	cis			
16-10	2-CH2OCH(Me)Ome-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[132-135]	cis			
16-11	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[107-110]	cis			
16-12	2-ON=C(Me)2-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[121-124]	cis			
16-13	2-ON=C(Me)Ome-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[108-111]	cis			
16-14	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CN	CH	CH	O	[153-155]	cis			

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
16-15	2-ON=C(Me)2-4-CF ₃	N	N	C-CN	CH	CH	O	[132-134]	cis
16-16	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[121-124]	cis
16-17	2-OiBu-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[107-110]	cis
16-18	2-CH(OH)CH ₂ iPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[72-75]	cis
16-19	2-OCH ₂ CH(F)Me-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[98-102]	cis
16-20	2-O(allyl)-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[101-104]	cis
16-21	2-O(propargil)-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[107-111]	cis
16-22	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[206-209]	Sulfato cis
16-23	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[220up]	Borato cis
16-24	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	CH	N	C-CN	CH	CH	O	nD _{23.3} - 1.5840	cis
16-25	2-OnPr-4-NO ₂	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[128-132]	cis
16-26	2-OnPr-4-Cl	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	nD _{23.4} - 1.5447	cis
16-27	4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[155-156]	cis
16-28	4-OCF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O		cis
16-29	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[101-105]	cis
16-30	2-OCH ₂ cPr-4-CN	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[136-138]	cis
16-31	2-NHnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[129-130]	cis
16-32	2-NHC ₂ cPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[131-132]	cis
16-33	2-Br-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[126-127]	cis
16-34	2-CF ₃ -3-Cl	N	CH	CH	N	CH	S		cis
16-35	4-CF ₃	N	CH	CH	N	CH	S		cis
16-36	4-CF ₃ -2-OnPr	N	CH	C-CF ₃	CH	N	S		cis
16-37	3-CF ₃	N	C-Br	CH	CH	N	SO		cis

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
16-38	3-Me		N CH	N	CH	N	SO ₂		cis
16-39	3-F	N	CH	C-CN	CH	N	NH		cis
16-40	2-CN	N	C-CN	CH	CH	N	Nme		cis
16-41	4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[159-160]	trans
16-42	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[131-133]	trans
16-43	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	[112-114]	trans
16-44	2-CF ₃ -3-Cl	N	N	C-CF ₃	CH	CH	S		trans
16-45	4-CF ₃	N	CH	CH	N	CH	S		trans
16-46	4-CF ₃ -2-OnPr	N	CH	CH	N	CH	S		trans
16-47	3-CF ₃	N	CH	C-CF ₃	CH	N	SO		trans
16-48	3-Me	N	C-Br	CH	CH	N	SO		trans
16-49	3-F	N	CH	N	CH	N	SO		trans
16-50	2-CN	N	CH	C-CN	CH	N	SO ₂		trans
16-51	3-NO ₂	N	C-CN	CH	CH	N	SO ₂		trans
16-52	4-CHO	N	N	C-CF ₃	CH	CH	SO ₂		trans
16-53	4-Ome	N	N	C-CF ₃	CH	CH	SO ₂		trans
16-54	4-cPr	N	N	C-CF ₃	CH	CH	NH		trans
16-55	2-OcHex	N	N	C-CF ₃	CH	CH	NH		trans
16-56	3-CH ₂ CH ₂ cPr	N	CH	CH	N	CH	NH		trans
16-57	4-OCH ₂ cPr	N	CH	CH	N	CH	Nme		trans
16-58	2-CHO	N	CH	CH	N	CH	Nme		trans
16-59	3-OCH=CHMe	N.	CH	CH	N	CH	Nac		trans
16-60	2-CO ₂ Et	N	CH	CH	N	CH	Nac		trans

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física [·]: Punto de fusión °C	Observación
16-61	4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[99-100]	cis
16-62	4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	Nac	[116-119]	cis
16-63	4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	Nme	[142-143]	cis
16-64	2-NO2-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[140-143]	cis
16-65	2-NO2-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	Nme	[124-127]	cis
16-66	2-NO2-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NnPr	amor	cis
16-67	2-NO2-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NnPr	amor	cis
16-68	2-NO2-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	Net	[112-114]	cis
16-69	2-Me-4-OCF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[89-90]	cis
16-70	2-Me-4-OCF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	Nme	nD24.6-1.5115	cis
16-71	2-Oet-4-tBu	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	vis	cis
16-72	2-Oet-4-tBu	N	CH	C-CF3	CH	CH	NME	vis	cis
16-73	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[85-87]	cis
16-74	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	Nme	[101-103]	cis
16-75	2-nBu-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[70-73]	cis
16-76	2,6-nBu2-4-CF3		N CH	C-CF3CH		CH	NH	nD22.0-1.5080	cis
16-77	5-Cl-2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	vis	cis
16-78	2,6-Me2-4-OCF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[70-73]	cis
16-79	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[103-104]	cis
16-80	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[107-109]	cis
16-81	2-OnPr-4-C(O)OtBu	N	CH	C-CF3	CH	CH	NH	[152-154]	cis
16-82	2-OnPr-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[95-99]	cis
16-83	2-OCH2cPr-4-CF3	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[87-89]	cis

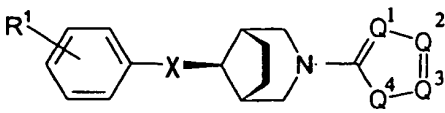
(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
16-84	2-OCH ₂ Ome-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[117-119]	cis
16-85	2-OCH ₂ CH ₂ Ome-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[90-92]	cis
16-86	2-OCH ₂ CH(Ome)Me-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[78-81]	cis
16-87	2-CO ₂ CHMe ₂ -4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[142-145]	cis
16-88	2-CH ₂ OCH(Me)Ome-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[119-122]	cis
16-89	2-ON=Cme ₂ -4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[120-122]	cis
16-90	2-ON=C(Ome)Me-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[124-127]	cis
16-91	2-ON=C(NH ₂)Me-4-CF ₃	N	CH	C-CN	CH	CH	O	[142-145]	cis

[Tabla 30-31]

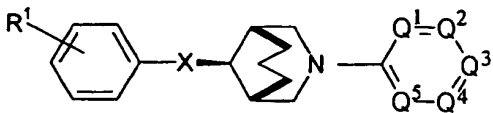
Compuesto nº	R ₁	Q ₁	Q ₂	Q ₃	Q ₄	X	Constante física []: Punto de fusión °C
17-1	2-OnPr-4-CF ₃	N	C-CF ₃	C-Br	S	O	vis
17-2	2-OnPr-4-CF ₃	N	C-CF ₃	CH	S	O	vis
17-3	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-CO ₂ Me	S	O	[90-91]
17-4	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-CH ₂ OH	S	O	[135-137]
17-5	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-CHO	S	O	[107-109]
17-6	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-CF ₂ H	S	O	vis
17-7	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	vis
17-8	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	nD _{22.3} -1.5038
17-9	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	nD _{22.4} -1.5148
17-10	2-ON=C(Me) ₂ -4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[113-115]
17-11	2-OnPr-4-CF ₃	CH	CH	CH	CH ₂	O	[140-142]
17-12	2-CF ₃ -3-Cl	CH	CH	CH	NH	S	
17-13	4-CF ₃	N	C-Cl	CH	NH	S	
17-14	4-CF ₃ -2-OnPr	N	CH	CH	NH	S	
17-15	3-CF ₃	N	C-CN	CH	NH	S	
17-16	3-Me	CH	CH	CH	O	SO	
17-17	3-F	C-Cl	CH	C-Cl	O	SO	
17-18	2-CN	N	CH	CH	O	SO	
17-19	3-NO ₂	N	CH	CH	O	SO	
17-20	4-CHO	CH	N	CH	O	SO	
17-21	4-OMe	CH	N	CH	O	SO ₂	
17-22	4-cPr	N	CH	CH	Nme	SO ₂	
17-23	2-OcHex	N	CH	CH	Nme	NH	
17-24	3-CH ₂ CH ₂ cPr	CH	N	CH	Nme	NH	
17-25	4-OCH ₂ cPr	CH	N	CH	Nme	NH	
17-26	2-CHO	CH	N	CH	Nme	Nme	

[Tabla 32]

							
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C
18-1	2-OnPr-4-CF3	N	NH	C-CF3	CH	O	[140-142]
18-2	2-OnPr-4-CF3	N	CH2	C-Br	CH	O	
18-3	2-OnPr-4-CF3	N	CMe2	CH	CH	O	
18-4	2-OnPr-4-CF3	N	O	C-CO2Me	CH	S	
18-5	2-OnPr-4-CF3	N	O	C-CH2O H	CH	S	
18-6	2-OnPr-4-CF3	N	S	C-CHO	CH	SO2	
18-7	2-OnPr-4-CF3	N	S	C-CF2H	C-Cl	NH	
18-8	2-OCH2cPr-4-CF3	N	NH	C-CF3	Cme	NH	
18-9	2-CO2iPr-4-CF3	N	Nme	C-CF3	C-CF3	NH	
18-10	2-OnPr-4-CF3	N	Nme	C-CF3	C-CF3	Nme	
18-11	2-ON=C(Me)2-4-CF3.	N	Nme	C-CF3	C-CF3	O	
18-12	2-OnPr-4-CF3	CH	Nme	CH	CH	O	

[Tablas 33-34]

5

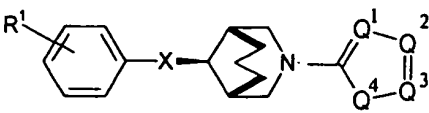
								
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C
19-1	2-OnPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[125-127]
19-2	2-OCH2cPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[115-118]
19-3	2-OEt-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[141-143]
19-4	2-OCH2OMe-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[118-121]
19-5	2-OiBu-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[130-133]
19-6	2-CO2iPr-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	amor
19-7	2-CH2OEt-4-CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[144-146]
19-8	2-OCH2CH(Me) OMe-4 -CF3	N	N	C-CF3	CH	CH	O	[114-115]

ES 2 375 639 T3

(continuación)

Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	X	Constante física []: Punto de fusión °C
19-9	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	O	vis
19-10	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	
19-11	2-OnPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	O	
19-12	4-CF ₃	N	CH	CH	N	C-Me	S	
19-13	2-CF ₃ -3-Cl	N	CH	CH	N	CH	S	
19-14	4-CF ₃	N	CH	C-CF ₃	N	CH	S	
19-15	4-CF ₃ -2-OnPr	N	C-Br	CH	N	CH	S	
19-16	3-CF ₃	N	CH	CH	CH	N	S	
19-17	3-Me	N	CH	C-CN	CH	CH	SO	
19-18	3-F	N	N	CH	CH	CH	SO	
19-19	2-CN	N	CH	N	CH	CH	SO	
19-20	3-NO ₂	CH	N	C-CN	CH	CH	SO ₂	
19-21	2-CH=CMe ₂	N	CH	CH	CH	N	SO ₂	
19-22	3-OCH=CF ₂	C-Me	N	CH	CH	CH	SO ₂	
19-23	4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ cPr	N	C-F	CH	CH	N	NH	
19-24	2-OnPr-4-CF ₃	N	C-Cl	CH	CH	N	NH	
19-25	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	N	CH	CH	NH	
19-26	4-CHO	CH	C-Me	N	C-Me	CH	N Me	
19-27	3-OCF ₃	N	N	C-CF ₃	CH	CH	N Me	
19-28	2-CO ₂ Et	N	N	CH	CH	CH	NA c	

[Tabla 35]

							
Compuesto nº	R1	Q1	Q2	Q3	Q4	X	Constante física []: Punto de fusión °C
20-1	2-OcPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	[116-119]
20-2	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	N	N	C-CF ₃	S	O	vis
20-3	4-CF ₃	N	CH	C-Br	CH ₂	O	
20-4	4-CF ₃ -2-OnPr	N	CMe	CH	CH ₂	O	
20-5	3-CF ₃	N	N	C-CO ₂ Me	CH ₂	O	
20-6	3-Me	N	N	C-CH ₂ OH	CH ₂	S	
20-7	3-F	N	CH	C-CHO	CH ₂ S		
20-8	2-CN	N	CH	C-CF ₂ H	CH ₂	S	
20-9	3-NO ₂	N	N	C-CF ₃	Cme ₂	S	
20-10	2-CH=Cme ₂	N	N	C-CF ₃	Cme ₂	SO	
20-11	3-OCH=CF ₂	N	N	C-CF ₃	Cme ₂	SO	
20-12	4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ cPr	N	N	C-CF ₃	CH ₂	SO ₂	
20-13	2-OnPr-4-CF ₃	CH	N	CH	CH ₂	SO ₂	
20-14	2-OnPr-4-CF ₃	N	CH	C-Br	CH ₂	SO ₂	
20-15	4-CHO	N	Cme	CH	CH ₂	NH	
20-16	3-OCF ₃	N	Cme	C-CO ₂ Me	CH ₂	NH	
20-17	4-cPr	CH	CH	N	NH	Nme	

[Tablas 36-39]



cis



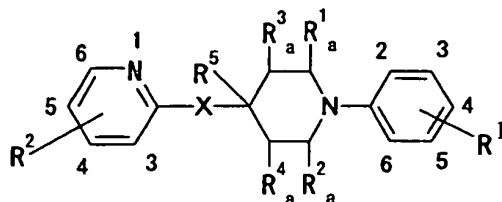
trans

Compuesto n°	Cy ¹	X	Y	Cy ¹	Constante física []: Punto de fusión °C	cis / trans
21-1		O	NH		vis	Cis
21-2		O	NH		165-167	Trans
21-3		O	NMe		vis	Cis
21-4		O	NCO ₂ Me		120-122	Cis
21-5		O	S		nD22.2-1.5418	Cis
21-6		O	SO ₂		155-158	Cis
21-7		O	O		156-157	Trans
21-8		O	O		124-125	Cis
21-9		O	O		125-126	Trans
21-10		O	O		vis	Cis

21-11		O	O		127-128	Trans
21-12		O	O		146-147	Cis
21-13		O	O		102-103	trans
21-14		O	S		125-128	Cis
21-15		O	S		52-55	Cis
21-16		O	S		136-138	Cis
21-17		O	SO2		200up	Cis
21-18		O	O		93-95	Cis
21-19		O	SO2			Cis
21-20		O	SO2			Trans
21-21		S	NH			Cis
21-22		S	S			Cis

21-23		S	S			Trans
21-24		S	O			Trans
21-25		SO	Nme			Cis
21-26		SO2	NH			Trans
21-27		NH	SO2			Cis
21-28		NH	S			Trans
21-29		Nme	O			Cis

[Tablas 40-42]



Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario. Cis y trans representan una relación posicional entre X y (R1 a, R2 a, R3 a, R4 a, o R5).

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
22-1	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	nD21.8-1.5022	
22-2	5-CF ₃	O	2-CHO-4-CF ₃	vis	
22-3	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	vis	
22-4	5-CF ₃	O	2-CH ₂ OCH(OMe) 4-CF ₃	90-92	
22-5	5-CF ₃	O	2-CH ₂ Oet-4-CF ₃	nD22.4-1.4919	
22-6	5-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	vis	R3 a= Et , trans
22-7	5-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	vis	R3 a= Et , cis
22-8	5-CF ₃	O	2-C(O)OiPr-4-CF ₃	84-86	
22-9	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	vis	R1 a= Et , trans
22-10	5-CF ₃	O	2-OnPr-4-CF ₃	vis	R1 a= Et , cis
22-11	5-CF ₃	O	4-CF ₃	nD22.3-1.5079	R1 a= Et , cis
22-12	5-CF ₃	O	4-CF ₃	nD22.2-1.5089	R1 a= Et , trans
22-13	5-CN	O	2-OnPr-4-CF ₃		
22-14	5-CF ₃	O	2-CHO-4-CF ₃		
22-15	3-Me	O	2-CH ₂ OH-4-CF ₃		
22-16	3-F	O	2-CH ₂ OCH(Ome) Me-4-CF ₃		R1 a = OH trans
22-17	5-CN	O	2-CH ₂ Oet-4-CF ₃		R1 a= F , cis
22-18	5-NO ₂	O	2-Cl-4-CF ₃		
22-19	5-CHO	S	2-C(O)OiPr-4-CF ₃		
22-20	4-Ome	S	2,6-(NO ₂) ₂ -4-CF ₃		
22-21	4-cPr	S	2-C(O)NHCH(Me) CH ₂ OhiPr-4-CF ₃		R3 a = Nme ₂ , trans
22-22	5-OcHex	S	2-CH=NOEt-4- CF ₃		R1 a = NO ₂ , cis

(continuación)

Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
22-23	3-CH ₂ CH ₂ cPr	S	2-CH=NoiPr-4- CF ₃		
22-24	4-OCH ₂ cPr	S	2-CH=NO- propargyl-4-CF ₃		
22-25	4-OCH=H ₂	S	2-(5-Me-oxazolin- 2-yl)-4-CF ₃		R _{3 a} = CN, trans
22-26	5-OCF ₃	S	2-CH ₂ Oet-4-CF ₃		
22-27	4- OCH=CHCH ₂ CF ₃	S	2-Ome-4-CF ₃		
22-28	4-CO ₂ Et	SO	2-CH=NoiPr-4- CF ₃		
22-29	6-F	SO	2-C(O)Oet-4-CF ₃		R _{3 a} = CHO, trans
22-30	6-CN	SO	2-C(O)OtBu-4- CF ₃		R _{1 a} = Ome, cis
22-31	6-NO ₂	SO ₂	2-C(O)OiPr-4- CF ₃		
22-32	6-OcPr	SO ₂	6-Cl-2-C (O) OiPr-4- CF ₃		R _{3 a} = OCF ₃ , trans
22-33	5-CN	SO ₂	2-CH=NOMe-4- CF ₃		R _{1 a} = CF ₃ , cis
22-34	5-CF ₃	SO ₂	2-CH=NOMe-4- CF ₃		
22-35	3-Me	SO ₂	2-C(O)OCH ₂ cPr- 4-CF ₃		
22-36	3-F	SO ₂	2-C(O)OCH ₂ CF ₃ -4-CF ₃		
22-37	5-CN	SO ₂	2-C(O)OiBu-4- CF ₃		
22-38	5-NO ₂	SO ₂	2-C(O)OnPr-4- CF ₃		
22-39	5-CHO	NH	2-CH(O)CH ₂ CH (Me) ₂ -4-CF ₃		R _{1 a} = Sme, cis
22-40	4-Ome	NH	2-C(O)OCH(Me) CH=CH ₂ -4-CF ₃		
22-41	5-CF ₃	NH	2-C(O)OcPen-4- CF ₃		R _{3 a} = CO ₂ Et, trans
22-42	4-CF ₃ -6-Cl	NH	2-C(O)ON=C (Me) ₂ -4-CF ₃		

(continuación)

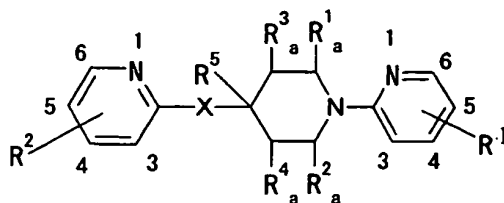
Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
22-43	5-CF ₃	NH	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃		
22-44	5-CF ₃ -6-OnPr	NH	2-Oet-4-CF ₃		
22-45	5-CF ₃	NH	2-C(O) OCH ₂ CHF ₂ -4-CF ₃		
22-46	3-Me	NH	2-OnBu-4-CF ₃		
22-47	3-F	NH	2-OnPr-4-CN		
22-48	5-CN	NH	2-C(O) OCH ₂ Ome-4-CF ₃		R _a 1 = C(S)Ome, cis
22-49	5-NO ₂	NH	2-C(O)OCH ₂ tBu-4-CF ₃		
22-50	5-CHO	NH	2-C(O)N(Me) ₂ -4-CF ₃		
22-51	4-Ome	NH	2-C(O)OCH(Me) CH(Me) ₂ -4-CF ₃		
22-52	4-cPr	NH	2-C(O)OCH(Et) ₂ -4-CF ₃		
22-53	5-OcHex	Nme	2-C(O)OtBu-4-CF ₃		R ₃ a = NHSO ₂ Me, trans
22-54	3-CH ₂ CH ₂ cPr	Nme	2-C(O)OiPr-4-CF ₃		R ₁ a = Ph , cis
22-55	4-OCH ₂ cPr	Nme	2-C(O)O (CH ₂) ₂ Ome-4-CF ₃		
22-56	6-Me	Nac	2-C(O)OCH(Me) CH ₂ Ome-4-CF ₃		
22-57	5-OcHex	Nac	2-C(O)OCH(CN) Me-4-CF ₃		
22-58	3-CH ₂ CH ₂ cPr	NAC	2-C(O)OCH(Cl) Et-4-CF ₃		
22-59	4-OCH=CH ₂	NCO ₂ Me	2-C(O)SiPr-4-CF ₃		
22-60	5-OCF ₃	NCO ₂ Me	2-Obn-4-CF ₃		R ₃ a = N(SO ₂ Me) ₂ , trans
22-61	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	NCO ₂ Me	2-OH-4-CF ₃		R ₁ a = Et , cis
22-62	4-CO ₂ Et	NCO ₂ Me	2-OCH ₂ CH(Me) Ome-4-CF ₃		

(continuación)

Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
22-63	4-CF ₃ -5-Cl	NCO ₂ Me	2-CH(OH) CH ₂ CN-4-CF ₃		
22-64	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃ 3	NCO ₂ Me	2-OnPr-4-CF ₃		
22-65	-	NCO ₂ Me	2-OCH ₂ cPr-4-C ₃ F ₇		
22-66	6-Me	NCO ₂ Me	4-Ph		
22-67	5-OcHex	NCO ₂ Me	2,3,4,5,6-F ₅		

[Tablas 43-45]

5



Notar que R_{1b}, R_{2b}, R_{3a}, R_{3b}, R_{4a}, R_{4b}, y R₅ representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario. Cis y trans representan una relación posicional entre X y (R_{1a}, R_{2a}, R_{3a}, R_{4a}, o R₅).

Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
23-1	5-CF ₃	O	5-CF ₃	84-86	
23-2	5-CF ₃ -6-Cl	O	5-CF ₃	nD22.0-1.5150	
23-3	5-CF ₃	O	5-CF ₃	nD22.0-1.5150	R _{3a} = Et, cis
23-4	3-Cl-5-CF ₃	O	5-CF ₃	nD22.3-1.5149	R _{3a} = Et, trans
23-5	5-CF ₃	O	5-CF ₃	nD22.4-1.5055	R _{3a} = Et, trans
23-6	5-CF ₃	O	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		R _{3a} = Et, trans
23-7	5-CF ₃	O	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		R _{3a} = Et, cis
23-8	5-CF ₃	O	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		
23-9	5-CF ₃	O	6-OnPr-4-CF ₃		R _{1a} = Et, trans
23-10	5-CF ₃	O	6-OnPr-4-CF ₃		R _{1a} = Et, cis
23-11	5-CF ₃	O	4-CF ₃		R _{1a} = Et, cis
23-12	5-CF ₃	O	4-CF ₃		R _{1a} = Et, trans
23-13	5-CN	O	5-OnPr-4-CF ₃		

ES 2 375 639 T3

(continuación)

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
23-14	5-CF ₃	O	3-CHO-4-CF ₃		
23-15	3-Me	O	3-CH ₂ OH-4-CF ₃		
23-16	3-F	O	3-CH ₂ OCH(OMe) Me-4-CF ₃		R1 a= OH , trans
23-17	5-CN	O	3-CH ₂ Oet-4-CF ₃		R1 a= F , cis
23-18	5-NO ₂	O	6-Cl-4-CF ₃		
23-19	5-CHO	S	5-C(O)OiPr-4-CF ₃		
23-20	4-Ome	S	5,6-(NO ₂) ₂ -4-CF ₃		
23-21	4-cPr	S	3-C(O)NHCH (Me)CH ₂ OH-4-CF ₃		R3 a= Nme ₂ , trans
23-22	5-OcHex	S	3-CH=NOEt-4-CF ₃		R1 a= NO ₂ , cis
23-23	3-CH ₂ CH ₂ cPr	S	3-CH=NoiPr-4-CF ₃		
23-24	4-OCH ₂ cPr	S	3-CH=NO-propargyl- 4-CF ₃		
23-25	4-OCH=CH ₂	S	3-(5-Me-oxazoline-2- yl)-4		R3 a= CN , trans
23-26	5-OCF ₃	S	5-CH ₂ Oet-4-CF ₃		
23-27	4-OCH=CHCH ₂ CH ₃	S	5-Ome-4-CF ₃		
23-28	4-CO ₂ Et	SO	5-CH=NoiPr-4-CF ₃		
23-29	6-F	SO	5-C(O)Oet-4-CF ₃		R3 a= CHO , trans
23-30	6-CN	SO	3-C(O)OtBu-4-CF ₃		R1 a= Ome , cis
23-31	6-NO ₂	SO ₂	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		
23-32	6-OcPr	SO ₂	6-Cl-2-C(O)OiPr-4- CF ₃		R3 a= OCF ₃ , trans
23-34	5-CN	SO ₂	3-CH=NOMe-4-CF ₃		R1 a= CF ₃ , cis
23-35	5-CF ₃	SO ₂	3-CH=NOMe-4-CF ₃		
23-36	3-Me	SO ₂	3-C(O)OCH ₂ cPr-4- CF ₃		
23-37	3-F	SO ₂	5-C(O) OCH ₂ CF ₃ -4- CF ₃		

ES 2 375 639 T3

(continuación)

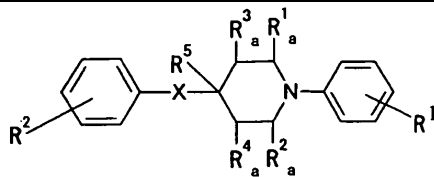
Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
23-37	5-CN	SO ₂	5-C(O)OiBu-4-CF ₃		
23-38	5-NO ₂	SO ₂	5-C(O)OnPr-4-CF ₃		
23-39	5-CHO	NH	5-CH(OH)CH ₂ CH (Me) ₂ -4-CF ₃		R1 a= Sme , cis
23-40	4-Ome	NH	5-C(O)OCH(Me) CH=CH ₂ -4-CF ₃		
23-41	5-CF ₃	NH	5-C(O)OcPen-4-CF ₃		R3 a = CO ₂ Et , trans
23-42	4-CF ₃ -6-Cl	NH	5-C(O)ON=C (Me) ₂ - 4-CF ₃		
23-43	5-CF ₃	NH	5-OCH ₂ cPr-4-CF ₃		
23-44	5-CF ₃ -6-OnPr	NH	5-Oet-4-CF ₃		
23-45	5-CF ₃	NH	6-C(O) OCH ₂ CHF ₂ - 4-CF ₃		
23-46	3-Me	NH	6-OnBu-4-CF ₃		
23-47	3-F	NH	6-OnPr-4-CN		
23-48	5-CN	NH	6-C(O) OCH ₂ Ome-4- CF ₃		R1 a = C(S)Ome , cis
23-49	5-NO ₂	NH	6-C(O)OCH ₂ tBu-4- CF ₃		
23-50	5-CHO	NH	6-C(O)N(Me) ₂ -4-CF ₃		
23-51	4-Ome	NH	6-C(O)OCH(Me) CH(Me) ₂ -4-CF ₃		
23-52	4-cPr	NH	3-C(O)OCH(Et) ₂ -4- CF ₃		
23-53	5-OcHex	Nme	3-C(O)Ome-4-CF ₃		R3 a = NHSO ₂ Me, trans
23-54	3-CH ₂ CH ₂ cPr	Nme	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		R1 a= Ph , cis
23-55	4-OCH ₂ cPr	Nme	3-C(O)O (CH ₂) ₂ Ome- 4-CF ₃		
23-56	6-Me	Nac	3-C(O)OCH(Me) CH ₂ Ome-4-CF ₃		
23-57	5-OcHex	Nac	3-C(O)OCH(CN) Me- 4-CF ₃		

ES 2 375 639 T3

(continuación)

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
23-58	3-CH ₂ CH ₂ cPr	NAC	3-C(O)OCH(Cl) Et-4-CF ₃		
23-59	4-OCH=CH ₂	NCO ₂ Me	3-C(O)S(iPr)-4-CF ₃		
23-60	5-OCF ₃	NCO ₂ Me	3-Obn-4-CF ₃		R3 a= N (SO ₂ Me) ₂ , trans
23-61	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	NCO ₂ Me	3-OH-4-CF ₃		R1 a= Et, cis
23-62	4-CO ₂ Et	NCO ₂ Me	5-OCH ₂ CH(Me) Ome-4-CF ₃		
23-63	6-F	NCO ₂ Me	5-C(O)OiPr-4-CF ₃		
23-64	6-CN	NCO ₂ Me	5-CH(OTMS) CH ₂ CN-4-CF ₃		
23-65	4-CF ₃ -5-Cl	NCO ₂ Me	5-CH(OH) CH ₂ CN-4-CF ₃		
23-66	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	NCO ₂ Me	5-OnPr-4-CF ₃		
23-67	-	NCO ₂ Me	5-OCH ₂ cPr-4-C ₃ F ₇		
23-68	6-Me	NCO ₂ Me	4-Ph		
23-69	5-OcHex	NCO ₂ Me	3,4,5,6-F ₄		

[Tablas 46-50]



Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario. Cis y trans representan una relación posicional entre X y (R1 a, R2 a, R3 a, R4 a, o R5).

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
24-1	4-CF ₃	O	2-NO ₂ -4-CF ₃	vis	
24-2	4-CF ₃	O	2-NH ₂ -4-CF ₃	80-82	
24-3	4-OCF ₃	O	2-NO ₂ -4-CF ₃	nD23.0-1.5210	
24-4	4-CF ₃	O	2-Br-4-CF ₃	nD23.0-1.5225	
24-5	4-CF ₃	O	2-Cl-4-CF ₃	61-64	
24-6	4-CF ₃	O	2-F-4-CF ₃	56-58	
24-7	4-CF ₃	O	4-CF ₃	102-105	
24-8	2-Cl-4-CF ₃	O	4-CF ₃	vis	
24-9	2-Cl-4-CF ₃	O	2-F-4-CF ₃	nD22.5-1.5076	
24-10	4-CF ₃	O	4-CF ₃	nD22.4-1.5111	R3 a= Et , cis
24-11	4-CF ₃	O	4-CF ₃	nD22.5-1.5055	R3 a= Et , trans
24-12	5-CF ₃	O	4-CF ₃		
24-13	4-CN	O	2-OnPr-4-CF ₃		
24-14	5-CF ₃	O	3-CHO-4-CF ₃		
24-15	4-Me	O	3-CH ₂ OH-4-CF ₃		
24-16	3-F	O	3-CH ₂ OCH(OMe) Me-4-CF ₃		R1 a= OH , trans
24-17	5-CN	O	2-CH ₂ Oet-4-CF ₃		R1 a= F , cis
24-18	5-NO ₂	O	6-Cl-4-CF ₃		
24-19	5-CHO	S	5-C(O)OiPr-4-CF ₃		
24-20	4-Ome	S	5,6-(NO ₂) ₂ -4-CF ₃		
24-21	4-cPr	S	3-C(O)NHCH (Me)CH ₂ OH-4-CF ₃		R3 a= Nme ₂ , trans
24-22	5-OcHex	S	3-CH=NOEt-4-CF ₃		R1a = NO ₂ , cis
24-23	3-CH ₂ CH ₂ cPr	S	3-CH=NoiPr-4-CF ₃		

ES 2 375 639 T3

(continuación)

Compuesto nº	R ₂	X	R ₁	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
24-24	4-OCH ₂ cPr	S	3-CH=NO- propargnil-4-CF ₃		
24-25	4-OCH=CH ₂	S	3-(5-Me-oxazolin- 2-yl)-4-CF ₃		
24-26	5-OCF ₃	S	5-CH ₂ Oet-4-CF ₃		
24-27	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	S	2-Ome-4-CF ₃		R _{3 a} = CN , trans
24-28	4-CO ₂ Et	SO	5-CH=NoiPr-4-CF ₃		
24-29	6-F	SO	5-C(O)Oet-4-CF ₃		R _{3 a} = CHO , trans
24-30	6-CN	SO	3-C(O)OtBu-4-CF ₃		R _{1 a} = Ome , cis
24-31	6-NO ₂	SO ₂	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		
24-32	6-OcPr	SO ₂	6-Cl-2-C(O)OiPr-4- CF ₃		trans
24-33	5-CN	SO ₂	3-CH=NOMe-4- CF ₃		R _{i a} = CF ₃ , cis
24-34	5-CF ₃	SO ₂	3-CH=NOMe-4- CF ₃		
24-35	3-Me	SO ₂	3-C(O)OCH ₂ cPr-4- CF ₃		
24-36	3-F	SO ₂	5-C(O) OCH ₂ CF ₃ - 4-CF ₃		
24-37	5-CN	SO ₂	5-C(O)OiBu-4-CF ₃		
24-38	5-NO ₂	SO ₂	5-C(O)OnPr-4-CF ₃		
24-39	5-CHO	NH	5-CH(OH)CH ₂ CH (Me) ₂ -4-CF ₃		R _{1 a} = Sme , cis
24-40	4-Ome	NH	5-C(O)OCH(Me) CH=CH ₂ -4-CF ₃		
24-41	5-CF ₃	NH	5-C(O)OcPen-4- CF ₃		R _{3a} = CO ₂ Et, trans
24-42	4-CF ₃ -6-Cl	NH	5-C(O)ON=C(Me) 2-4-CF ₃		
24-43	5-CF ₃	NH	5-OCH ₂ cPr-4-CF ₃		

ES 2 375 639 T3

(continuación)

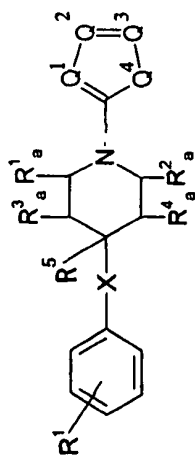
Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
24-44	5-CF ₃ -6-OnPr	NH	5-Oet-4-CF ₃		
24-45	5-CF ₃	NH	6-C(O) OCH ₂ CHF ₂ -4-CF ₃		
24-46	3-Me	NH	6-OnBu-4-CF ₃		
24-47	3-F	NH	6-OnPr-4-CN		
24-48	5-CN	NH	6-C(O) OCH ₂ Ome- 4-CF ₃		R _{1 a} = C(S)Ome, cis
24-49	5-NO ₂	NH	6-C(O)OCH ₂ tBu-4- CF ₃		
24-50	5-CHO	NH	6-C(O)N(Me) ₂ -4- CF ₃		
24-51	4-Ome	NH	6-C(O)OCH(Me) CH(Me) ₂ -4-CF ₃		
24-52	4-cPr	NH	3-C(O)OCH(Et) ₂ - 4-CF ₃		
24-53	5-OcHex	Nme	3-C(O)Ome-4-CF ₃		R _{3 a} = NHSO ₂ Me, trans
24-54	3-CH ₂ CH ₂ cPr	Nme	3-C(O)OiPr-4-CF ₃		R _{1 a} = Ph , cis
24-55	4-OCH ₂ cPr	Nme	3-C(O)O (CH ₂) ₂ Ome-4-CF ₃		
24-56	6-Me	Nac	3-C(O)OCH(Me) CH ₂ Ome-4-CF ₃		
24-57	5-OcHex	Nac	3-C(O)OCH(CN) Me-4-CF ₃		
24-58	3-CH ₂ CH ₂ cPr	NAC	3-C(O)OCH(Cl) Et- 4-CF ₃		
24-59	4-OCH=CH ₂	NCO ₂ Me	3-C(O)SiPr-4-CF ₃		
24-60	5-OCF ₃	NCO ₂ Me	3-Obn-4-CF ₃		R _{3 a} = N(SO ₂ Me) ₂ , trans
24-61	4-OCH=CHCH ₂	NCO ₂ Me	3-OH-4-CF ₃		R _{1 a} = Et , cis
24-62	4-CO ₂ Et	NCO ₂ Me	5-OCH ₂ CH(Me) Ome-4-CF ₃		
24-63	6-F	NCO ₂ Me	5-C(O)OiPr-4-CF ₃		
24-64	6-CN	NCO ₂ Mc	S-CH(OTMS) CH ₂ CN-4-CF ₃		
24-65	4-CF ₃ -5-Cl	NCO ₂ Me	5-CH(OH) CH ₂ CN- 4-CF ₃		

ES 2 375 639 T3

(continuación)

Compuesto nº	R2	X	R1	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
24-66	CH ₃ CF ₃	NCO ₂ Me	5-OnPr-4-CF ₃		
24-67	-	NCO ₂ Me	5-OCH ₂ CPr-4- C ₃ F ₇		
24-68	6-Me	NCO ₂ Me	4-Ph		
24-69	5-OcHex	NCO ₂ Me	3,4,5,6-F ₄		

[Tablas 50-53]



Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario. Cis y trans representan una relación posicional entre X y (R1 a, R2 a, R3 a, R4 a, o R5).

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
25-1	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	S	nD22.2-1.4992	R3 a=Et, cis
25-2	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	S	nD22.2-1.4998	R3a=Et, trans
25-3	4-CF3	O	N	N	C-CF3	S	nD22.5-1.5041	R3 a=Et, trans
25-4	4-CF3	O	N	N	C-CF3	S	nD22.5-1.5034	R3a=Et, cis
25-5	4-CF3	O	N	N	C-CF3	S	[85-86]	
25-6	4-Cl	O	N	N	C-CF3	S	nD22.8-1.5354	R3 a=Et, trans
25-7	4-CF3	O	N	C-Cl	N	S	[61-62]	
25-8	3-Cl	O	N	N	C-CF3	S	nD25.9-1.5374	R3 a=Et, cis
25-9	3-Cl	O	N	N	C-CF3	S	nD26.3-1.5368	R3 a= Et , trans
25-10	4-Cl	O	N	N	C-CF3	S	nD26.3-1.5368	R3 a=Et, cis
25-11	2-Cl	O	N	N	C-CF3	S	nD25.1-1.5414	R3a=Et, cis
25-12	2-Cl	O	N	N	C-CF3	S	nD25.5-1.5266	R3 8Et , trans
25-13	5-CN	O	N	CH	C-Br	CH2		
25-14	5-NO2	O	N	CMe	CH	CH2		
25-15	5-CHO	O	N	N	C-CO2Me	CH2		
25-16	4-Ome	O	N	N	C-CH2OH	CH2		

(continuación)

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
25-17	4-cPr	O	N	CH	C-CHO	CH ₂		
25-18	5-OcHex	O	N	CH	C-CF ₂ H	CH ₂		R1 a=CHO, trans
25-19	3-CH ₂ CH ₂ cPr	O	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		R1 a=CN, trans
25-20	4-OCH ₂ cPr	O	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-21	4-OCH=CH ₂	S	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-22	5-OCF ₃	S	N	N	C-CF ₃	CH ₂		R3 a=CO ₂ Me, trans
25-23	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	S	CH	N	CH	CH ₂		R3 a=Br, trans
25-24	4-CO ₂ Et	S	N	CH	C-Br	CH ₂		
25-25	6-F	S	N	Cme	CH	CH ₂		
25-26	6-CN	S	N	Cme	C-CO ₂ Me	CH ₂		
25-27	6-NO ₂	S	CH	CH	N	NH		
25-28	6-OcPr	S	N	CH	C-Br	CH ₂		
25-29	5-CN	S	N	Cme	CH	CH ₂		
25-30	5-CF ₃	S	N	N	C-CO ₂ Me	CH ₂		
25-31	3-Me	S	N	N	C-CH ₂ OH	CH ₂		
25-32	3-F	S	N	CH	C-CHO	CH ₂		
25-33	5-CN	SO	N	CH	C-CF ₂ H	CH ₂		
25-34	5-NO ₂	SO	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-35	5-CHO	SO	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-36	4-Ome	SO	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-37	5-CF ₃	SO	N	N	C-CF ₃	CH ₂		
25-38	4-CF ₃ -6-Cl	SO ₂	CH	N	CH	CH ₂		
25-39	5-CF ₃	SO ₂	N	CH	C-Br	CH ₂		

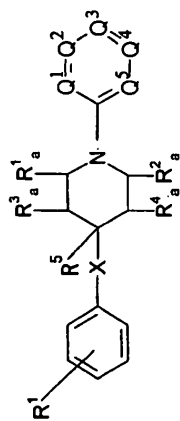
(continuación)

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
25-40	5-CF ₃ -6-OnPr	SO ₂	N	Cme	CH	CH ₂		R _{1 a} =CF ₃ , cis
25-41	5-CF ₃	SO ₂	N	Cme	C-CO ₂ Me	CH ₂		R _{1 a} =Ome, cis
25-42	3-Me	SO ₂	CH	CH	N	NH		R _{3 a} =Nme ₂ , trans
25-43	3-F	SO ₂	N	CH	C-Br	CH ₂		
25-44	5-CN	SO ₂	N	Cme	CH	CH ₂		
25-45	5-NO ₂	SO ₂	N	N	C-CO ₂ Me	CH ₂		
25-46	5-CHO	SO ₂	N	N	C-CH ₂ OH	CH ₂		
25-47	4-Ome	SO ₂	N	CH	C-CHO	CH ₂		
25-48	4-cPr	SO ₂	N	CH	C-CF ₂ H	CH ₂		
25-49	5-OcHex	NH	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-50	3-CH ₂ CH ₂ cPr	NH	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		R _{3 a} =NO ₂ , trans
25-51	4-OCH ₂ cPr	NH	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		R _{3 a} =Me, cis
25-52	6-Me	NH	N	N	C-CF ₃	CH ₂		
25-53	5-OcHex	NH	CH	N	CH	CH ₂		
25-54	3-CH ₂ CH ₂ cPr	NH	N	CH	C-Br	CH ₂		
25-55	4-OCH=CH ₂	NH	N	Cme	CH	CH ₂		
25-56	5-OCF ₃	NH	N	Cme	C-CO ₂ Me	CH ₂		
25-57	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	NH	CH	CH	N	NH		
25-58	4-CO ₂ Et	NH	N	CH	C-Br	CH ₂		
25-59	6-F	NH	N	Cme	CH	CH ₂		
25-60	6-CN	Nme	N	N	C-CO ₂ Me	CH ₂		R _{3 a} =F, cis
25-61	4-CF ₃ -5-Cl	Nme	N	N	C-CH ₂ OH	CH ₂		R _{3 a} =Et, trans
25-62	4-OCH=CHCH ₂ CF ₃	Nme	N	CH	C-CHO	CH ₂		

(continuación)

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
25-63	-	Nme	N	CH	C-CF ₂ H	CH ₂		
25-64	6-Me	Nme	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-65	5-OcHex	Nme	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-66	5-CN	Nme	N	N	C-CF ₃	Cme ₂		
25-67	5-NO ₂	Nac	N	N	C-CF ₃	CH ₂		R1 a=SO ₂ Me, trans
25-68	5-CHO	Nac	CH	N	CH	CH ₂		R1 a=Et, cis
25-69	4-Ome	Nac	N	CH	C-Br	CH ₂		
25-70	4-cPr	Nac	N	Cme	CH	CH ₂		

[Tablas 54-57]



Notar que R1b, R2b, R3a, R3b, R4a, R4b, y R5 representan un átomo de hidrógeno, respectivamente, a menos que se indique lo contrario. Cis y trans representan una relación posicional entre X y (R1 a, R2 a, R3 a, R4 a, o R5).

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	Constante física []: Punto de fusión °C	Observación
26-1	2-OEt-4-CF3	O	N	C-OiPr	N	C-CF3	CH	vis	
26-2	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	[106-109]	
26-3	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	vis	R3 a=Me, cis
26-4	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	vis	R3 a=Me, trans
26-5	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	nD22.3-1.4992	R3 a=Et, cis
26-6	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	Amorfo	R3 a=Et, trans
26-7	-	O	N	N	C-Cl	CH	CH	vis	R3 a=Et, cis
26-8	4-CF3	O	N	N	C-Cl	CH	CH	nD26.3-1.5522	R3 a=Et, trans
26-9	4-CF3	O	N	N	C-CN	CH	CH	Amorfo	R3 a=Et, cis
26-10	4-CF3	O	N	N	C-CN	CH	CH	vis	R3 a=Et, trans
26-11	4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	[108-109]	
26-12	4-CF3	O	N	CH	N	C-CF3	CH	nD26.1-1.5093	R3 a=Et, cis
26-13	4-CF3	O	N	CH	N	C-CF3	CH	nD26.2-1.5088	R3 a=Et, trans
26-14	4-CF3	O	N	C-CF3	N	CH	CH	nD22.4-1.5071	R3 a=Et, trans
26-15	4-CF3	O	N	N	C-Cl	CH	CH	[120-121]	
26-16	4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	nD25.5-1.5148	R3 a=Et, cis

(continuación)

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	Constante física [·]: Punto de fusión °C	Observación
26-17	4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	[89-90]	R3 a=Et, trans
26-18	4-CF3	O	H	N	C-Cl	CH	CH	nD25.2-1.5471	R3 a=Et, cis
26-19	4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH	[89-90]	R3 8=Et, trans
26-20	2-OnPr-4-CF3	O	CH	CH	CH	CH	CH		
26-21	4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH		R3a=F, trans
26-22	2-OnPr-4-CF3	O	N	N	C-CF3	CH	CH		R1 a=Nme2, cis
26-23	4-CF3	O	N	CH	CH	N	C-Me		
26-24	2-CH2OEt4-cF3	O	N	CH	CH	N	CH		
26-25	4-CF3	S	N	CH	C-CF3	N	CH		
26-26	2.6-Me2	S	N	C-Br	CH	N	CH		
26-27	4-OMe	S	N	CH	CH	CH	N		
26-28	3-NO2	S	N	CH	C-CN	CH	CH		
26-29	2-F	S	N	C-CN	CH	CH	CH		R3 a=CN, cis
26-30	3-CHO	S	N	CH	N	CH	CH		R3 a=NO2, trans
26-31	3-OiPr	S	CH	N	C-CN	CH	CH		
26-32	4-Me	S	N	CH	CH	CH	N		
26-33	4-cPr	S	C-Me	N	CH	CH	CH		
26-34	3-OcPr	SO	N	C-F	CH	CH	N		R1 a=CHO, cis
26-35	4-CH2cPr	SO	N	C-Cl	CH	CH	N		R1 a=OCF3, trans
26-36	2-OCH2CH2cPr	SO	N	CH	N	CH	CH		
26-38	3-OCH=CMe2	SO	CH	C-Me	N	C-Me	CH		
26-39	4-OCF3	SO	N	N	C-CF3	CH	CH		
26-40	4-OCF3	SO2	N	N	CH	CH	CH		R1 a=OMe, cis

(continuación)

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	Constante física [°C]: Punto de fusión	Observación
26-41	3-CO ₂ Me	SO ₂	CH	CH	CH	CH	CH		R _{1 a} =CO ₂ Et, trans
26-42	3-Me	SO ₂	N	N	C-CF ₃	CH	CH		
26-43	4-tBu	SO ₂	N	N	C-CF ₃	CH	CH		
26-44	2-CH=CHMe	SO ₂	N	CH	CH	N	C-Me		
26-45	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	SO ₂	N	CH	CH	N	CH		
26-46	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	SO ₂	N	CH	C-CF ₃	N	CH		
26-47	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	SO ₂	N	C-Br	CH	N	CH		
26-48	2-OnBu-4-CF ₃	SO ₂	N	CH	CH	CH	N		
26-49	2-OiBu-4-CF ₃	NH	N	CH	C-CN	CH	CH		
26-50	2-OEt-4-CF ₃	NH	N	C-CN	CH	CH	CH		
26-51	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	NH	N	CH	N	CH	CH		
26-52	2-OnPr-4-CF ₃	NH	CH	N	C-CN	CH	CH		
26-53	4-CF ₃	NH	N	CH	CH	CH	N		R _{3 a} =Et, trans
26-54	2-OnPr-4-CF ₃	NH	C-Me	N	CH	CH	CH		R _{1 a} =C(S)OMe, cis
26-55	4-CF ₃	NH	N	C-F	CH	CH	N		
26-56	2-CH ₂ OEt-4-+CF ₃	NH	N	C-Cl	CH	CH	N		
26-57	4-CF ₃	NH	N	CH	N	CH	CH		
26-58	2,6-Me ₂	NH	CH	C-Me N		C-Me	CH		
26-59	3-OCH=CMe ₂	NMe	CH	CH	CH	CH	CH		R _{1 a} =tBu, trans
26-60	4-OCF ₃	NMe	N	N	C-CF ₃ 3	CH	CH		R _{3 a} =CH ₂ cPr, cis
26-61	4-OCF ₃	NMe	N	N	C-CF ₃	CH	CH		
26-62	3-CO ₂ Me	NMe	N	CH	CH	N	C-Me		
26-63	4-tBu	Nme	N	CH	C-CF ₃	N	CH		

(continuación)

Compuesto nº	R1	X	Q1	Q2	Q3	Q4	Q5	Constante física [·]: Punto de fusión °C	Observación
26-64	2-CH=CHMe	NAC	N	C-Br	CH	N	CH		
26-65	2-OCH ₂ cPr-4-CF ₃	NAC	N	CH	CH	CH	N		R1 a=Et, trans
26-66	3-OCH=CMe ₂	NAC	N	CH	C-CN	CH	CH		R3 a=OMe, cis
26-67	4-OCF ₃	NAC	N	C-CN	CH	CH	CH		
26-68	2-OCH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	O	N	CH	C-CN	CH	CH	[57-60]	

Ejemplos de formulación

[Insecticidas/acaricidas]

5 Aunque a continuación se muestran algunos ejemplos con respecto a las composiciones de la presente invención, los aditivos y las proporciones agregadas se pueden cambiar en un amplio intervalo sin limitarse a estos ejemplos. Las partes en los ejemplos de formulación muestran partes en peso.

10 Ejemplo de formulación 1 – Polvo humectable

Compuesto de la presente invención	40 partes
Tierra de diatomeas.....	53 partes
Éster sulfato de alcohol superior.....	4 partes
15 Sal de alquilnaftalenosulfonato.....	3 partes

Los componentes anteriormente mencionados se mezclaron en forma homogénea y se molieron finamente para obtener un polvo humectable con 40% de principio activo.

20 Ejemplo de formulación 2 – Emulsión

Compuesto de la presente invención.....	30 partes
Xileno.....	33 partes
Dimetilformamida.....	30 partes
25 Polioxietileno alquil alil éter.....	7 partes

Los componentes anteriormente mencionados se mezclaron y disolvieron para obtener una emulsión con 30% de principio activo.

30 Ejemplo de formulación 3 – Polvo para espolvorear

Compuesto de la presente invención.....	10 partes
Talco.....	89 partes
35 Polioxietileno alquil alil éter.....	1 parte

Los componentes anteriormente mencionados se mezclaron en forma homogénea y se molieron finamente para obtener polvo para espolvorear con 10% de principio activo.

40 Ejemplo de formulación 4 – Gránulos

Compuesto de la presente invención.....	5 partes
Arcilla.....	73 partes
Bentonita.....	20 partes
Sal dioctilsulfosuccinato de sodio.....	1 parte
45 Fosfato de sodio.....	1 parte

Los componentes anteriormente mencionados se mezclaron y se molieron bien y, después de agregar agua y amasar todos juntos, se granularon y secaron para obtener gránulos con 5% de principio activo.

50 Ejemplo de formulación 5 – Agente de suspensión

Compuesto de la presente invención.....	10 partes
Lignina sulfonato de sodio.....	4 partes
Dodecibencenosulfonato de sodio.....	1 parte
55 Goma xantano.....	0,2 partes
Agua.....	84,8 partes

Los componentes anteriormente mencionados se mezclaron y se sometieron a molido en húmedo hasta que se alcanzó el tamaño del grano de 1 μm o menos para obtener un agente de suspensión con 10% de principio activo.

60 A continuación, la utilidad de los compuestos de la presente invención como ingredientes de acaricidas e insecticidas se muestra mediante los ejemplos de prueba.

Ejemplo de prueba 1 – Efectividad contra *Tetranychus urticae*

65 Se inocularon 17 hembras adultas de *Tetranychus urticae*, que eran resistentes a los plaguicidas, en la primera hoja

verdadera de una judía común, que se sembró en un recipiente con un diámetro de 9 cm, en donde pasaron 7 a 10 días después de la germinación. Después de la inoculación, se aplicó la solución de la medicina, que se preparó siguiendo el método del polvo humectable mostrado en el Ejemplo 1 de las medicinas y diluyendo con agua para lograr la concentración del compuesto de 125 ppm. EL recipiente se colocó en un ambiente de temperatura controlada en el que la temperatura y la humedad se fijaron a 25°C y 65%, respectivamente, y la tasa adulticida se examinó 3 días después de la aplicación. La prueba se repitió dos veces.

Como resultado, los compuestos indicados a continuación mostraron la tasa insecticida de 100%:

1-1, 1-4 a 1-7, 1-10, 1-13, 1-17, 1-18, 1-21 a 1-29, 1-31 a 1-36, 1-39 a 1-47, 1-50, 1-51, 1-54, 2-3, 3-1, 4-5, 4-7, 4-9, 4-13, 4-16, 4-18 a 4-20, 4-53 a 4-55, 4-58 a 4-61, 4-64, 4-70, 4-71, 5-1 a 5-8, 10-1, 11-1, 13-2, 15-1, 15-17, 16-1 a 16-26, 16-61, 16-65, 16-69, 16-73 a 16-75, 16-78, 16-82 a 16-91, 17-2, 17-3, 17-7 a 17-10, 19-1 a 19-3, 21-1, 21-3, 21-5, 21-6, 21-14 a 21-16, 22-1, 22-4, 22-5, 23-2, 25-1, 25-2, 26-3 a 26-6.

15 **Ejemplo de prueba 2** – Efectividad contra *Panonychus citri*

Se inocularon 10 hembras adultas de *Panonychus citri* en la hoja de un árbol de mandarina, que se colocó en un disco de Petri. Después de la inoculación, se aplicó la solución de la medicina, que se preparó siguiendo el método de la emulsión mostrado en el Ejemplo 2 de las medicinas y diluyendo con agua para lograr la concentración del compuesto de 125 ppm, usando una torre de pulverización rotativa. El disco se colocó en un ambiente de temperatura controlada en el que la temperatura y la humedad se fijaron en 25°C y 65%, respectivamente, se retiraron los adultos 3 días después de la aplicación y se examinó si los huevos puestos durante esos 3 días podían crecer a adultos al 11º día.

Como resultado, los compuestos indicados a continuación mostraron la tasa insecticida de 100%:

1-1, 1-5, 1-7, 1-13, 1-17, 1-24, 1-31, 1-32, 1-47, 1-50, 3-1, 4-5, 4-53, 4-54, 4-58 a 4-61, 4-64, 4-70, 4-71, 5-1, 5-2, 5-4, 5-8, 10-1, 12-4, 16-1 a 16-3, 16-15 a 16-20, 16-22, 16-23, 16-26, 16-61, 16-73, 16-83, 16-84, 16-89 a 16-91, 17-9, 17-10, 19-1 a 19-3, 21-5, 21-6, 21-13, 22-1, 22-4, 23-2, 26-3, 26-5, 26-6.

30 **Ejemplo de prueba 3** – Prueba de efectividad contra *Pseudaletia separata*

Se colocaron 0,2 ml de una dieta artificial comercialmente disponible (Insecta LFS fabricado por Nihon Nosan-Kogyo Co. Ltd.) en un tubo de ensayo de plástico con un volumen de 1,4 ml y se usó como una dieta de prueba. El compuesto se ajustó para preparar una solución al 1% usando dimetilsulfóxido que contenía 0,5% de Tween 20 y esta solución se aplicó agregando de a gotas sobre la superficie de la dieta en una cantidad equivalente a 10 µg del compuesto. Se inocularon 2 larvas de segundo instar de *Pseudaletia separate* en cada tubo de ensayo y los tubos fueron sellados con tapas de plástico. Los tubos se dejaron a 25°C y se examinó la tasa insecticida y la cantidad de alimento ingerido después de 5 días. La prueba se repitió dos veces.

En la presente prueba, los compuestos indicados a continuación fueron efectivos mostrando una tasa insecticida de 100% o la cantidad de alimento ingerido era de 10% o menos comparado con el grupo control con solvente. 4-3, 4-4, 16-1, 16-2, 17-3, 17-7 a 17-9, 25-4.

45 **Ejemplo de prueba 4** – Prueba de efectividad contra *Culex pipiens molestus*

Se colocaron 10 larvas de *Culex pipiens molestus*, que habían salido 1 día antes, y 0,225 ml de agua destilada que contenía 0,5 mg de alimento para peces de acuario (TetraMin® fabricado por Tetra Japan Co. Ltd.) en un recipiente de prueba de poliestireno con un volumen de 0,3 ml. El compuesto se ajustó para preparar una solución al 1% usando dimetilsulfóxido que contenía 0,5% de Tween 20 y diluido adicionalmente a 0,01% con agua destilada. Se agregaron 0,025 ml de esta solución de medicina diluida al recipiente de prueba con *Culex pipiens molestus* y se agitó (concentración final del compuesto 0,001%). Los recipientes se dejaron a 25°C y se examinó la tasa insecticida después de 2 días. La prueba se repitió dos veces.

En la presente prueba, el compuesto indicado a continuación fue efectivo mostrando la tasa insecticida de 90% o más.

4-3.

Si bien se han descrito e ilustrado anteriormente las formas de realización preferidas de la invención, debería apreciarse que son únicamente ejemplificativas y no limitativas de la invención. Pueden introducirse adiciones, omisiones, sustituciones y otras modificaciones sin apartarse del alcance de la presente invención. Por lo tanto, la invención no debe considerarse como limitada por la descripción anterior, y está únicamente limitada por el alcance de las reivindicaciones adjuntas.

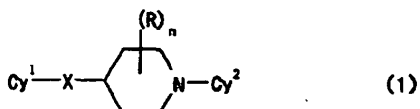
Aplicabilidad industrial

5 De acuerdo con la presente invención, es posible proporcionar agentes para el control de plagas con excelentes bioactividades, especialmente en términos de actividades insecticidas/acaricidas y de alta seguridad, y además, es posible proporcionar compuestos de aminos cíclicos con una nueva estructura, sales de los mismos o N-óxidos de los mismos.

REIVINDICACIONES

1. Agentes para el control de plagas que comprenden compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (1):

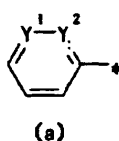
5



o sus sales o sus N-óxidos como un principio activo,

10 en la que

Cy¹ representa uno seleccionado de entre el grupo constituido por un heterociclo de 5 miembros y un grupo representado por la fórmula (a) a continuación:



15 en la que

Y¹ e Y², cada uno independientemente, representa nitrógeno o carbono y el símbolo * representa las posiciones de unión;

20 X representa uno seleccionado de entre el grupo constituido por oxígeno, azufre, sulfinilo, sulfonilo, y nitrógeno; cada R puede formar un anillo cuando n es un entero de 2 o más y R, que no forma un anillo, representa un hidroxilo, halógeno, amino, metilamino, bencilamino, anilino, dimetilamino, dietilamino, feniletilamino, alquilsulfonilamino, arilsulfonilamino, heteroarilsulfonilamino, alquilcarbonilamino, alcocixarbonilamino, haloalquilsulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis(haloalquilsulfonil)amino, nitro, ciano, formilo, alquilo, alcoxycarbonilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltriacarbonilo, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis(haloalquilsulfonilo)amino, alcocixarbonilo, o arilo;

25

n es un entero de 0 a 9 y cada R puede ser igual o diferente cuando n es 2 o más;

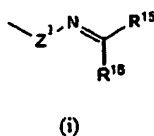
30 Cy² representa uno seleccionado de entre el grupo constituido por un hidrocarburo cíclico y un heterociclo

Cy¹ y Cy², y el nitrógeno de X pueden ser sustituidos opcionalmente por un sustituyente seleccionado de entre el grupo constituido por hidroxilo, tiol, halógeno, ciano, nitro, formilo, amino, metilamino, bencilamino, anilino, dimetilamino, dietilamino, feniletilamino, alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, heteroariloxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltiocarbonilo, alquilsulfonilamino, arilsulfonilamino, heteroarilsulfonilamino, alquilcarbonilamino, alcocixarbonilamino, haloalquilsulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis(haloalquilsulfonilo)amino, hidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, alcocixarbonilo, arilo, aralquilo, heterociclo de 5 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado, heterociclo de 6 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 6 miembros insaturado, grupo heterocíclico saturado, grupo alquilo heterocíclico saturado, N-dimetilaminoiminometilo, 1-N-feniliminoetilo, N-hidroxiiminometilo, N-metoxiiminometilo, N'-metilhidrazinocarbonilo, N'-fenilhidrazinocarbonilo, hidrazinocarbonilo, aminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, N-fenil-N-metilaminocarbonilo, N'-acetilhidrazino, N'-metilhidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, N'-2-propilidenedihidrazino, alquiltio, alqueniltio, alquiniltio, ariltio, heteroariltio, aralquiltio, alquilsulfonilo, alquenilsulfonilo, alquinilsulfonilo, arilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, aralquilsulfonilo, y los grupos funcionales representados por la fórmula (i);

35

40

45



50 [en la fórmula, R¹⁵ y R¹⁶ representan cada uno independientemente hidrógeno, hidrocarburo, grupo heterocíclico, amino, hidrocarbonoxi, o hidrocarbontio,

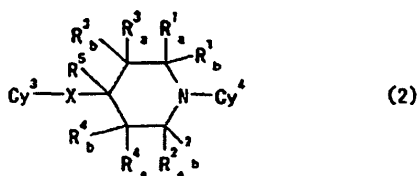
R¹⁵ y R¹⁶ pueden unirse para formar un anillo, en este caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo, y

Z¹ representa oxígeno o nitrógeno];

5 con la condición de que Cy² es piridin-2-ilo, que es sustituido con por lo menos uno o más cianos, cuando Cy¹ es un fenilo sustituido o no sustituido y Cy² es piridin-2-ilo.

10 2. Agentes para el control de plagas según la reivindicación 1, en los que los agentes para el control de plagas son insecticidas o acaricidas.

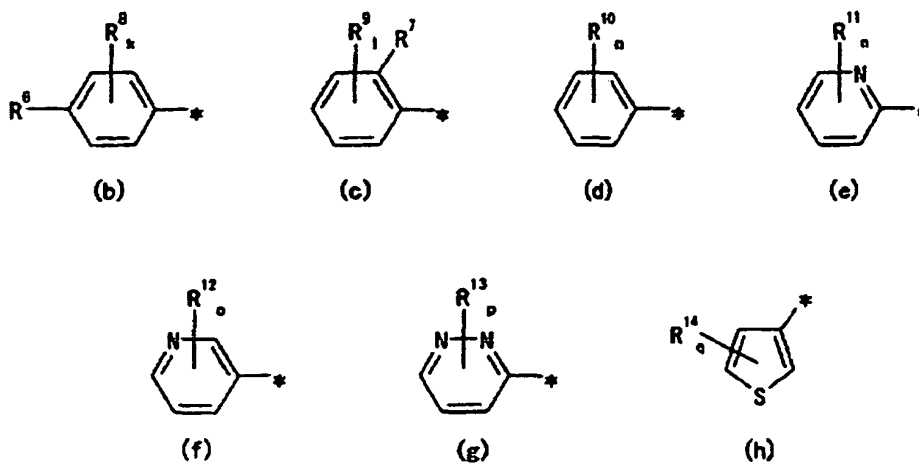
3. Compuestos de aminas cíclicas representados por la fórmula (2):



15 o sus sales, o sus N-óxidos,

en la que

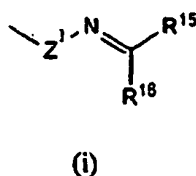
20 Cy³ representa cualquiera de las fórmulas (b) a (h) a continuación:



en las que

25 R⁶ representa haloalquilo o haloalcoxi,

R⁷ representa alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxialquilo, o un grupo funcional representado por la fórmula (i) a continuación:



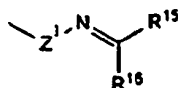
30 en la que R¹⁵ y R¹⁶, cada uno independientemente, representa hidrógeno, hidrocarburo, un grupo heterocíclico, amino, hidrocarbonoxi o hidrocarbontio,

R¹⁵ y R¹⁶ pueden unirse para formar un anillo, en ese caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo, y

Z¹ representa oxígeno o nitrógeno sustituido o no sustituido,

R⁸ a R¹⁴, cada uno independientemente, representa hidroxilo, tiol, halógeno, nitro, formilo, ciano, haloalquilo, haloalcoxi, haloalquenilo, alquilo (opcionalmente sustituido con G¹), alcoxi (opcionalmente sustituido con G¹), alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, arilo (opcionalmente sustituido con G¹), o el grupo funcional representado por la fórmula (i),

G¹ representa hidroxilo, halógeno, amino, nitro, ciano, formilo, metilamino, bencilamino, anilino, dimetilamino, dietilamino, feniletilamino, alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, heteroariloxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltiocarbonilo, alquilsulfonilamino, arilsulfonilamino, heteroarilsulfonilamino, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, haloalquilsulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis(haloalquilsulfonil)amino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, alcoxycarbonilo, arilo, aralquilo, heterociclo de 5 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado, heterociclo de 6 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 6 miembros insaturados, grupo heterocíclico saturado, grupo alquilo heterocíclico saturado, N-dimetilaminoiminometilo, 1-N-feniliminometilo, N-hidroxiiminometilo, N-metoxiiminometilo, N'-metilhidrazinocarbonilo, N'-fenilhidrazinocarbonilo, hidrazinocarbonilo, aminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, N-fenil-N-metilaminocarbonilo, N'-acetilhidrazino, N'-metilhidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, N'-2-propilidenhidrazino, alquiltio, alqueniltio, alquiniltio, ariltio, heteroariltio, aralquiltio, alquilsulfonilo, alquenilsulfonilo, alquinilsulfonilo, arilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, aralquilsulfonilo, o los grupos funcionales representados por la fórmula (i);



(i)

[en la fórmula, R¹⁵ y R¹⁶ representan cada uno independientemente hidrógeno, hidrocarburo, grupo heterocíclico, amino, hidrocarbonoxi, o hidrocarbontio,

R¹⁵ y R¹⁶ pueden unirse para formar un anillo, en este caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo, y

Z¹ representa oxígeno o nitrógeno];

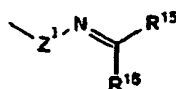
k, l, n y o, cada uno independientemente representa cualquiera de un entero de 0 a 4 y cada R⁸, cada R⁹, cada R¹¹ y cada R¹², pueden ser iguales o diferentes, cuando k, l, n y o son 2 o más,

m es cualquiera de un entero de 0 a 5 y cada R¹⁰ puede ser igual o diferente cuando m es 2 o más,

p y q, cada uno independientemente, representa cualquiera de un entero de 0 a 3 y cada R¹³ y cada R¹⁴ puede ser igual o diferente cuando p y q son 2 o más;

X representa uno seleccionado de entre el grupo constituido por oxígeno, azufre, sulfinilo, sulfonilo, y nitrógeno y

el nitrógeno de X puede ser sustituido opcionalmente por un sustituyente seleccionado de entre el grupo constituido por hidroxilo, tiol, halógeno, ciano, nitro, formilo, amino, metilamino, bencilamino, anilino, dimetilamino, dietilamino, feniletilamino, alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, heteroariloxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltiocarbonilo, alquilsulfonilamino, arilsulfonilamino, heteroarilsulfonilamino, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, haloalquilsulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis(haloalquilsulfonil)amino, hidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, alcoxycarbonilo, arilo, aralquilo, heterociclo de 5 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado, alquinilsulfonilo, arilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, aralquilsulfonilo, y los grupos funcionales representados por la fórmula (i);



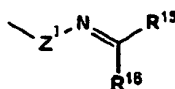
(i)

[en la fórmula, R¹⁵ y R¹⁶ representan cada uno independientemente hidrógeno, hidrocarburo, grupo heterocíclico, amino, hidrocarbonoxi, o hidrocarbontio,

R¹⁵ y R¹⁶ pueden unirse para formar un anillo, en este caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo, y

Z¹ representa oxígeno o nitrógeno];

5 R¹_a y R²_a, R¹_a y R⁴_a, R²_a y R³_a o R³_a y R⁴_a, pueden formar juntos anillos saturados y R¹_a, R¹_b, R²_a, R²_b, R³_a, R³_b, R⁴_a, R⁴_b, y R⁵, que no forman juntos anillos saturados, representan cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, amino, nitro ciano, formilo, alquilo, alcoxicarbonilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltiocarbonilo, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, bis(alquilsulfonilo)amino, bis(haloalquilsulfonil)amino, arilo, metilamino, bencilamino, anilino, dimetilamino, dietilamino, feniletilamino, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, heteroariloxi, arilsulfonilamino, heteroarilsulfonilamino, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, alcoxicarbonilo, aralquilo, heterociclo de 5 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 5 miembros insaturado, heterociclo de 6 miembros insaturados, heterociclo alquilo de 6 miembros insaturado, grupo heterocíclico saturado, grupo alquilo heterocíclico saturado, N-dimetilaminoiminometilo, 1-N-feniliminoetilo, N-hidroxiiminometilo, N-metoxiiminometilo, N'-metilhidrazinocarbonilo, N'-fenilhidrazinocarbonilo, hidrazinocarbonilo, aminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, N-fenil-N-metilaminocarbonilo, N'-acetilhidrazino, N'-metilhidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, N'-2-propilidenhidrazino, alquiltio, alqueniltio, alquiniltio, ariltio, heteroariltio, aralquiltio, alquilsulfonilo, alquenilsulfonilo, alquinilsulfonilo, arilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, aralquilsulfonilo, o los grupos funcionales representados por la fórmula la fórmula (i); heterociclo de 6 miembros insaturado, heterociclo alquilo de 6 miembros insaturado, grupo heterocíclico saturado, grupo alquilo heterocíclico saturado, N-dimetilaminoiminometilo, 1-N-feniliminoetilo, N-hidroxiiminometilo, N-metoxiiminometilo, N'-metilhidrazinocarbonilo, N'-fenilhidrazinocarbonilo, e hidrazinocarbonilo, aminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, N-fenil-N-metilaminocarbonilo, N'-acetilhidrazino, N'-metilhidrazino, N'-fenilhidrazino, N'-metoxicarbonilhidrazino, N'-2-propilidenhidrazino, alquiltio, alqueniltio, alquiniltio, ariltio, heteroariltio, aralquiltio, alquilsulfonilo, alquenilsulfonilo,



(i)

[en la fórmula, R¹⁵ y R¹⁶ representan cada uno independientemente hidrógeno, hidrocarburo, grupo heterocíclico, amino, hidrocarbonoxi, o hidrocarbontio,

R¹⁵ y R¹⁶ pueden unirse para formar un anillo, en este caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo, y

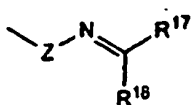
Z¹ representa oxígeno o nitrógeno];

Cy⁴ representa piridin-2-ilo sustituido con uno o más de ciano, piridin-3-ilo, piridazin-3-ilo, pirazinilo, tiazol-2-ilo, pirimidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, o fenilo, que son opcionalmente sustituidos con G² cuando Cy³ es un grupo funcional representado por las fórmulas (c), (g) o (h),

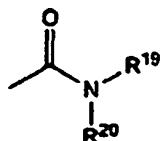
piridin-2-ilo sustituido con uno o más de ciano, piridin-3-ilo, piridazin-3-ilo, pirazinilo, tiazol-2-ilo, pirimidin-2-ilo, o 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, que son opcionalmente sustituidos con G² cuando Cy³ es un grupo funcional representado por las fórmulas (b), (e) o (f), y

piridin-2-ilo sustituido con uno o más de ciano, pirazinilo, o 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, que son opcionalmente sustituidos con G² cuando Cy³ es un grupo funcional representado por la fórmula (d);

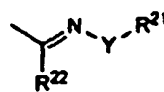
G² representa hidroxilo, halógeno, ciano, nitro, formilo, alquilo (opcionalmente sustituido con G³), alcoxi (opcionalmente sustituido con G³), haloalquilo, haloalcoxi, alquiltiocarbonilo, alquilsulfonilamino, haloalquil-sulfonilamino, bis(alquilsulfonil)amino, bis-(haloalquilsulfonil)amino, alcoxicarbonilo, arilo (opcionalmente sustituido con G¹), un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros (que contiene por lo menos un heteroátomo entre oxígeno, nitrógeno y azufre), el grupo funcional representado por las fórmulas (j) a (l):



(j)



(k)



(l)

en las que R^{17} y R^{18} , cada uno independientemente, representa hidrógeno, un hidrocarburo, un grupo heterocíclico, amino, hidrocarbonoxi, o hidrocarbontio,

5 R^{19} y R^{22} , cada uno independientemente, representa hidrógeno, un hidrocarburo, un grupo heterocíclico, o amino,

R^{20} representa hidrógeno o un hidrocarburo,

R^{21} representa hidrógeno, un hidrocarburo, o un grupo heterocíclico,

10 Y y Z cada uno independientemente representa oxígeno o nitrógeno,

R^{17} y R^{18} , R^{19} y R^{20} , y R^{21} y R^{22} pueden unirse para formar anillos y en ese caso, los dos grupos en el par representan grupos funcionales, que pueden integrarse para formar un anillo,

15 y

G^3 representa hidroxilo, ciano, alcoxi, alcoxi-alcoxi, o trialquilsililoxi.

20