

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 376 074**

51 Int. Cl.:

C07F 5/06 (2006.01)

C07D 413/04 (2006.01)

C07D 251/54 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 403/04 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08862791 .4**

96 Fecha de presentación: **25.11.2008**

97 Número de publicación de la solicitud: **2231679**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **29.09.2010**

54 Título: **SÍNTESIS DE BIGUANIDINAS Y TRIAZINAS Y COMPLEJOS DE BIGUANIDINO-ALUMINIO
COMO INTERMEDIOS.**

30 Prioridad:
14.12.2007 EP 07024256

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
08.03.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
08.03.2012

73 Titular/es:
**Bayer CropScience AG
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:
FORD, Mark, James

74 Agente/Representante:
Carpintero López, Mario

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).

ES 2 376 074 T3

DESCRIPCIÓN

Síntesis de biguanidinas y triazinas y complejos de biguanidino-aluminio como intermedios

La invención se refiere al campo técnico de los procedimientos químicos para la preparación de compuestos heterocíclicos, de forma particular a la preparación de triazinas simétricas (s-triazinas), e intermedios para la misma, mediante formación del anillo del anillo de triazina. Las s-triazinas preferiblemente son ingredientes activos en el campo farmacéutico, agroquímico o de productos químicos finos o son intermedios de los mismos.

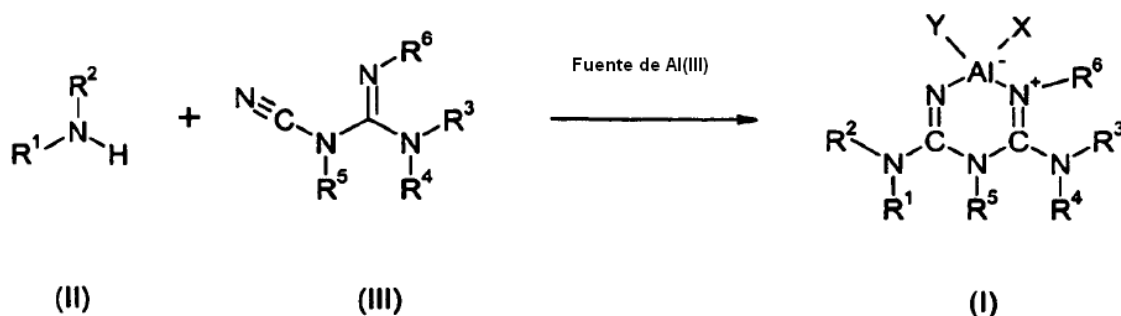
Se encuentra bien documentado en la bibliografía que se pueden preparar sales de biguanidina a partir de la reacción de cianamida y sales de guanidina o sales de cianoguanidina y amonio a altas temperaturas en solución o como una masa fundida. Incluso en el más simple de los casos estas síntesis son frecuentemente inespecíficas, conducen a rendimiento bajo y dan mezclas en las que son difíciles de obtener el producto. Esto es principalmente debido al hecho de que la temperatura requerida para la reacción, frecuentemente supera con mucho los 120° C, de modo tal que se descompone el producto de biguanidina por sí mismo de forma reversible dando los derivados de guanidina y cianamida relacionados que pueden tomar parte por sí mismos en la reacción. Además a partir de los productos secundarios producidos estas descomposiciones pueden ser extremadamente exotérmicas y como tales impiden llevar a cabo una reacción como esta a una escala industrial. Un ejemplo de esto es que en algunos casos se ha documentado que en condiciones de reacción virtualmente idénticas algunas aminas dan impredeciblemente sólo el producto de mono-guanidina con bajo rendimiento (J. Amer. Chem. Soc. 81, 3728, 1959, véase por ejemplo en la página 3735 con 2-ciclohexiletilamina). De forma alternativa, para algunos casos en los que la fusión o ebullición en ácido fuerte no son apropiados, se conoce el uso de sales de cobre (por ejemplo, sulfato de cobre) para promover la formación de la biguanidina como el complejo de cobre de bisguanidino, aunque sólo en rendimientos de pobres a modestos (Ber. 62B, 1398 (1929) y J. Amer. Chem. Soc. 81, 3728, ejemplo en página 3735 con 2-pirid-2-iletilamina). Adicionalmente tales complejos, incluyendo aquellos, por ejemplo, de níquel, cobalto y cromo, son tan estables que se han considerado que son de carácter pseudoaromático (J. Indian Chem. Soc. 54, 127 (1977)). Como tales, de forma esperada y desafortunadamente, se debe usar el gas H₂S en exceso o derivados de azufre relacionados con el fin de liberar la biguanidina del complejo de metal pesado de biguanidino fuertemente unido tal como el complejo de cobre (Inorg. Synth. 7, 56 (1963)). Tales síntesis son por tanto de poco valor técnico.

Sin embargo la biguanidinas sustituidas y las triazinas derivadas de ellas han encontrado amplia aplicación como compuestos farmacéuticos, biocidas y agroquímicos. Por tanto la formación y reacción de biguanidinas en condiciones suaves, limpias y de alto rendimiento es de gran importancia y un desafío técnico permanente.

Se han descrito complejos de aluminio y biguanidina en un artículo de Nandi, S.D: y col. en Zeitschrift für Naturforschung, Parte B: Anorganische Chemie, Organische Chemie, Biochemie, Biophysik, Biologie (1974), 29 (5-6), páginas 347-8 (este documento está resumido y anexado por CAS en Chemical Abstract Número: 81:144912 en el fichero CA).

Es reseñable y sorprendente que se ha encontrado que derivados de aluminio son particularmente adecuados para la formación de biguanidinas a partir de aminas y cianoguanidinas. La reacción es suave, tiene lugar de forma limpia, lo más frecuentemente en condiciones que no se esperarían, basadas en precedentes de la bibliografía, conduciendo a productos de adición, y es de una naturaleza general en lo que respecta a la amina (esquema 1).

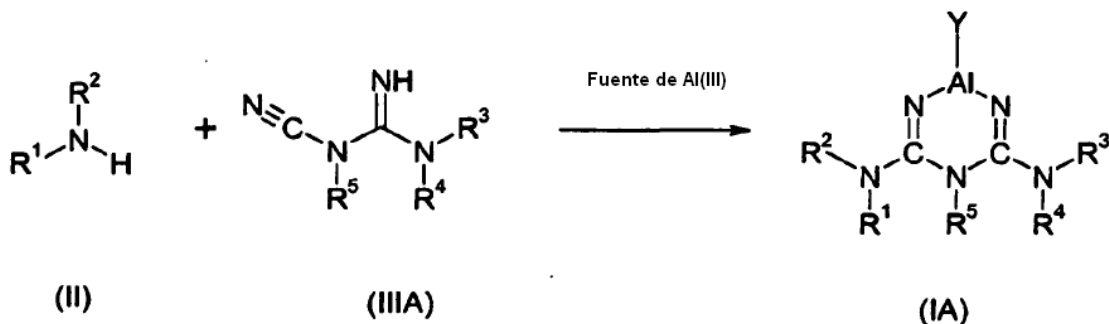
Esquema 1:



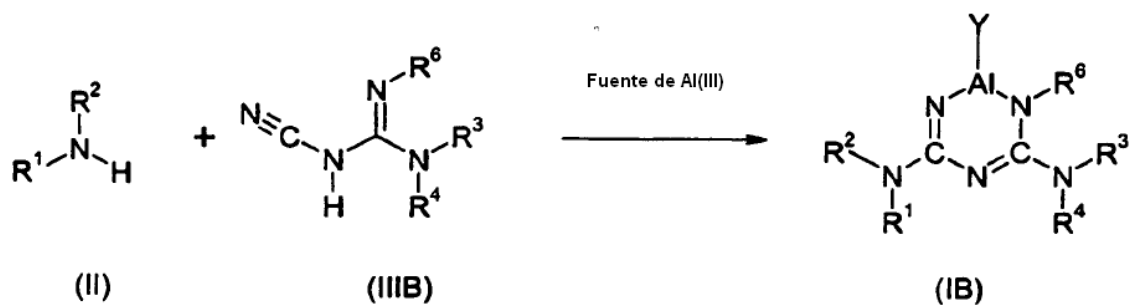
Los ligandos X e Y del complejo de aluminio mostrado en la fórmula (I) pueden proporcionarse a partir de la fuente de aluminio, el disolvente u otros componentes añadidos de la mezcla de reacción. La fórmula (I) muestra solo una de las posibles estructuras de resonancia del complejo de aluminio. Por ejemplo la carga positiva se puede localizar también en el átomo de N unido al grupo R⁵ o al átomo de N del grupo NR³R⁴. La fórmula (I) debería representar todas las estructuras de resonancia o tautómeros del complejo de aluminio, que están en equilibrio con la mostrada en la fórmula (I) explícitamente o se puede formar fácilmente a partir de la misma en la mezcla de reacción. Lo mismo puede ser válido también para otras fórmulas químicas consideradas más adelante.

En caso de que R^6 o R^5 o ambos sean átomos de hidrógeno en la fórmula (III) el material de partida está representado con la fórmula (IIIA) o (IIIB) o (IIIC), respectivamente, y la reacción puede tener lugar dando compuestos de fórmula (I) que no están en forma de una sal; véase los compuestos de fórmula (IA), (IB) o (IC) en los esquemas 1a, 1b o 1c, respectivamente (en cualquier caso sólo se muestra una de las estructuras de resonancia o tautoméricas para los complejos de aluminio).

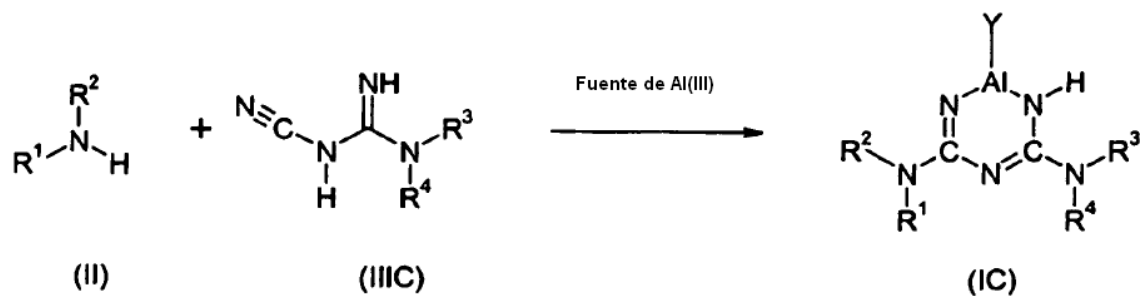
Esquema 1a:



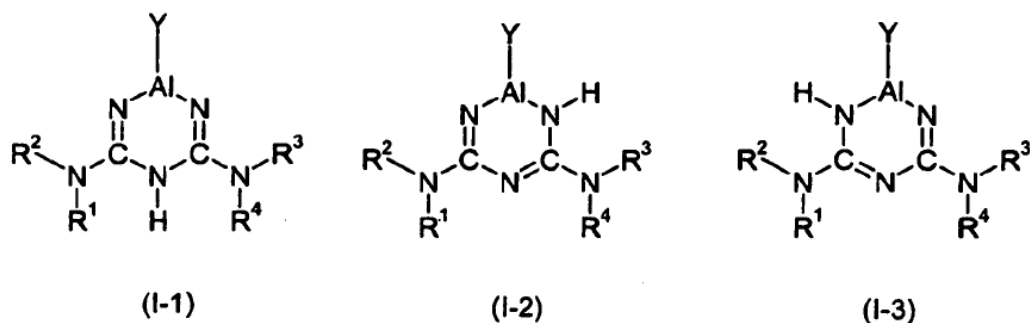
Esquema 1b:



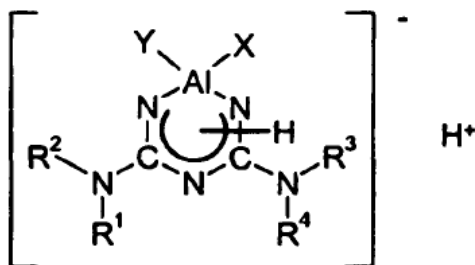
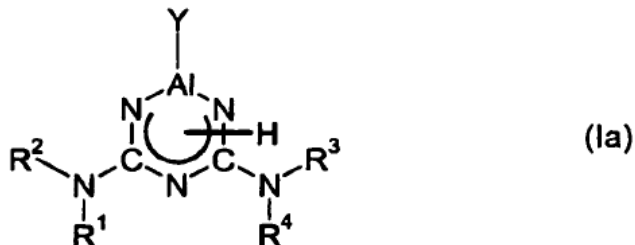
Esquema 1c:



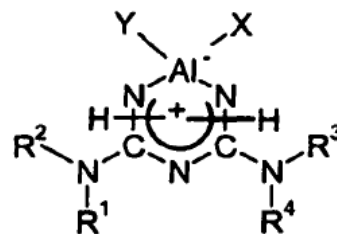
Especialmente en el caso de fórmula (IC) el átomo de hidrógeno en el complejo formado se puede mover y luego formar tautómeros donde está unido el átomo de hidrógeno saturado a cualquiera de los átomos de N en el compuesto, principalmente a los átomos de N en el anillo. Los tautómeros principales en el caso de que R^5 y R^6 sean ambos átomos de hidrógeno, son los siguientes:



Los tautómeros juntos y las sales de adición de ácido de los mismos (HX añadido) se representan también con la fórmula (Ia) (forma no de sal) o (Ib) (forma de sal, complejo de aluminio como anión) o (Ic) (forma de sal = sal de adición de HX = complejo de aluminio como sal interna con mayor coordinación que presenta cuatro ligandos en el átomo de Al):



(Ib)



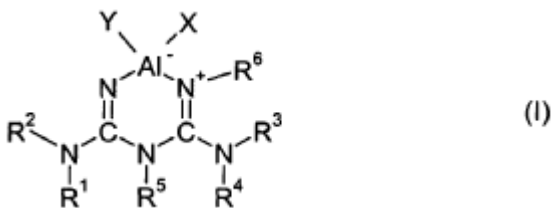
(Ic)

5

Los compuestos de fórmula general (I) en la que R⁵ y R⁶ son ambos hidrógeno debería representar también tautómeros (Ia) en la forma no sal y formas de sal (Ib) y (Ic) y estructuras de resonancia respectivas, y complejos de adición de mayor coordinación (véase, por ejemplo, complejos con 5 ligandos más a continuación), a menos que se consideren específicamente tautómeros específicos o estructuras de complejo. Aplica lo mismo en casos en los que R⁵ o R⁶ o ambos sean diferentes del hidrógeno, de acuerdo con lo anterior.

10

La invención se refiere de este modo o se relaciona con nuevos complejos de aluminio de fórmula (I), o sales, dímeros o polímeros de los mismos (en pocas palabras "sales de los mismos").



15

en la que

R¹ es alquilo (C₁-C₁₈), alquenilo (C₂-C₁₈) o alquinilo (C₂-C₁₈), en los que cada uno de los tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{1a}, -S-R^{1b}, -S(=O)-R^{1c}, -S(=O)₂-R^{1d}, -NR^{1e}R^{1f}, -C(=O)-NHR^{1g}, -C(=O)-NR^{1h}R¹ⁱ, -NHC(=O)-NR^{1j}R^{1k} y A^{1a}, en las que R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^{1f}, R^{1g}, R^{1h}, R¹ⁱ, R^{1j}, y R^{1k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{1b}, o es un grupo de fórmula A¹ o B¹,

20

R² es H, alquilo (C₁-C₁₈), alquenilo (C₂-C₁₆) o alquinilo (C₂-C₁₈), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{2a},

25

$-S-R^{2b}$, $-S(=O)-R^{2c}$, $-S(=O)_2-R^{2d}$, $-NR^{2e}R^{2f}$, $-C(=O)-NHR^{2g}$, $-C(=O)-NR^{2h}R^{2i}$, $-NHC(=O)-NR^{2j}R^{2k}$ y A^{2a} , en las que R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} , R^{2g} , R^{2h} , R^{2i} , R^{2j} , y R^{2k} , independientemente unos de otros, son alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6) o un radical de fórmula A^{2b} , o es un grupo de fórmula A^2 ,

5 R^3 es H, alquilo (C_1-C_{1a}), alquenilo (C_2-C_{18}) o alquinilo (C_2-C_{18}), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas $-O-R^{3a}$, $-S-R^{3b}$, $-S(=O)-R^{3c}$, $-S(=O)_2-R^{3d}$, $-NR^{3e}R^{3f}$, $-C(=O)-NHR^{3g}$, $-C(=O)-NR^{3h}R^{3i}$, $-NHC(=O)-NR^{3j}R^{3k}$ y A^{3a} , en los que R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} , R^{3f} , R^{3g} , R^{3h} , R^{3i} , R^{3j} , y R^{3k} , independientemente unos de otros, son alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6) o un radical de fórmula A^{3b} , o es un grupo de fórmula A^3 ,

10 R^4 es H, alquilo (C_1-C_{18}), alquenilo (C_2-C_{18}) o alquinilo (C_2-C_{18}), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas $-O-R^{4a}$, $-S-R^{4b}$, $-S(=O)-R^{4c}$, $-S(=O)_2-R^{4d}$, $-NR^{4e}R^{4f}$, $-C(=O)-NHR^{4g}$, $-C(=O)-NR^{4h}R^{4i}$, $-NHC(=O)-NR^{4j}R^{4k}$ y A^{4a} , en las que R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} , R^{4d} , R^{4e} , R^{4f} , R^{4g} , R^{4h} , R^{4i} , R^{4j} , y R^{4k} , independientemente unos de otros, son alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6) o un radical de fórmula A^{4b} , o es un grupo de fórmula A^4 ,

15 R^5 es H, alquilo (C_1-C_{18}), alquenilo (C_2-C_{18}) o alquinilo (C_2-C_{18}), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas $-O-R^{5a}$, $-S-R^{5b}$, $-S(=O)-R^{5c}$, $-S(=O)_2-R^{5d}$, $-NR^{5e}R^{5f}$, $-C(=O)-NHR^{5g}$, $-C(=O)-NR^{5h}R^{5i}$, $-NHC(=O)-NR^{5j}R^{5k}$ y A^{5a} , en las que R^{5a} , R^{5b} , R^{5c} , R^{5d} , R^{5e} , R^{5f} , R^{5g} , R^{5h} , R^{5i} , R^{5j} , y R^{5k} , independientemente unos de otros, son alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6) o un radical de fórmula A^{5b} , o es un grupo de fórmula A^5 ,

20 R^6 es H, alquilo (C_1-C_{18}), alquenilo (C_2-C_{18}) o alquinilo (C_2-C_{18}), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas $-O-R^{6a}$, $-S-R^{6b}$, $-S(=O)-R^{6c}$, $-S(=O)_2-R^{6d}$, $-NR^{6e}R^{6f}$, $-C(=O)-NHR^{6g}$, $-C(=O)-NR^{6h}R^{6i}$, $-NHC(=O)-NR^{6j}R^{6k}$ y A^{6a} , en las que R^{6a} , R^{6b} , R^{6c} , R^{6d} , R^{6e} , R^{6f} , R^{6g} , R^{6h} , R^{6i} , R^{6j} , y R^{6k} , independientemente unos de otros, son alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6) o un radical de fórmula A^{6b} , o es un grupo de fórmula A^6 , o

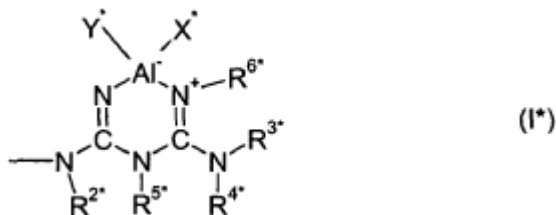
25 R^1 y R^2 o R^3 y R^4 junto con el átomo de N unido a cada uno de los otros forma un anillo heterociclo que presenta de 3 a 7 átomos de anillo y de forma opcional presenta uno o más heteroátomos adicionales seleccionados del grupo que consiste en N, O y S y que está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo y oxo,

30 A^1 , A^{1a} , A^{1b} , A^2 , A^{2a} , A^{2b} , A^3 , A^{3a} , A^{3b} , A^4 , A^{4a} , A^{4b} , A^5 , A^{5a} , A^{5b} , A^6 , A^{6a} , y A^{6b} , independientemente unos de otros, son cicloalquilo (C_3-C_9), cicloalquenilo (C_4-C_9), cicloalquinilo (C_5-C_9), arilo o heterociclilo como un resto cíclico básico, en el que el resto cíclico básico está no sustituido o sustituido, preferiblemente

35 (a) está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino y en caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo de N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o

40 (b) está sustituido con o sustituido adicionalmente con uno o más de los sustituyentes citados en (a) por un puente unido geminalmente (una posición 1,1), vicinalmente (una posición 1,2) o en una posición 1,3 en el resto cíclico básico formando de este modo otro anillo carbocíclico o heterocíclico junto con la parte del resto cíclico básico entre los átomos unidos al puente, preferiblemente mediante un puente unido en una posición vicinal del resto cíclico básico formando así un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado con el resto cíclico básico, en el que el anillo carbocíclico o heterocíclico formado está saturado, parcialmente insaturado, insaturado, aromático o heteroaromático y en el que el puente está no sustituido o sustituido adicionalmente, preferiblemente está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino,

B¹ es un grupo como se define para R¹ unido adicionalmente al grupo amino del grupo de fórmula (I*)



en la que R^{2*}, R^{3*}, R^{4*}, R^{5*}, R^{6*}, X* e Y* son independientemente como se definen en la fórmula (I) para R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, X e Y, respectivamente,

5 X e Y cada uno, independientemente uno de otro, se seleccionan del grupo que consiste en

(i) amino,

(ii) un grupo de fórmula NR⁷R⁸ en la que R⁷ es un radical seleccionado del grupo que consiste en radicales como se definen para e independientemente de R¹, y en la que R⁸ es un radical seleccionado del grupo que consiste en radicales como se definen para e independientemente de R², preferiblemente un grupo de fórmula NR⁷R⁸ que se define como el grupo NR⁴R² en la fórmula (I),

(iii) hidroxilo,

(iv) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆) y alquil (C₁-C₆)-tio,

(v) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆) y alquil (C₁-C₆)-tio, en los que cada uno de los últimos 4 radicales está sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆),

en la que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), arilo y ariloxi,

en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

(vi) cicloalcoxi (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆),

(vii) ariloxi que está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

y

(viii) aciloxi, aciltio o acilamino, preferiblemente aciloxi,

más preferiblemente se seleccionan cada uno de ellos de los grupos anteriores (ii), (iv), (v), (vi), (vii) y (viii), más preferiblemente de los grupos anteriores (ii), (iv) y (v), o

X e Y juntos son un grupo divalente de fórmula -U¹-D*-U²- en la que

D* es un puente hidrocarburo, opcionalmente interrumpido con uno o más grupos divalentes de fórmula U³ definida anteriormente, o, preferiblemente, es un puente alquilenilo lineal, un puente alquilenilo (C₂-C₁₀) lineal, un puente alquilenilo (C₂-C₁₀) lineal, un puente cicloalquilenilo (C₃-C₉), un puente fenileno o un puente que consiste en una combinación de dos o más de dichos restos acíclicos y cíclicos lineales que presentan en total de 4 a 24 átomos de carbono, en el que el puente en cada caso está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆),

alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino, y

5 U¹, U² y U³, independientemente uno de otro se seleccionan del grupo que consiste en NH, NR', O y S, en la que

R' es alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), o

10 X es un radical como se define anteriormente e Y es un ligando orgánico basado en un compuesto de fórmula Y'-H, Y'-R^L o R^L-U³-D*-U⁴-R^{LL} en la que D* es un grupo divalente como se definió para el grupo D* anteriormente, Y' es un radical como se definió para Y, U³ es un grupo divalente como se definió para U¹ anteriormente, U⁴ es un grupo divalente como se definió para U² anteriormente, cada uno de R^L y R^{LL} es un grupo radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alquilo (C₁-C₆), o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en el que el ligando orgánico está coordinado con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre de un heteroátomo contenido en el mismo y seleccionado del grupo que

15 consiste en N, O y S,

o

20 X e Y juntos son un radical de fórmula -U¹-D*-U²-R^{LLL}, en la que U¹, U² y D* son como se definieron anteriormente, y R^{LLL} es un radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en la que el radical -U¹-D*-U²-R^{LLL} está coordinado adicionalmente con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre localizado en un heteroátomo contenido en el radical (posición representada por Y), preferiblemente localizado en el heteroátomo del grupo divalente U².

En la presente memoria descriptiva, incluyendo las reivindicaciones que acompañan, los sustituyentes anteriormente citados presentan los siguientes significados:

25 halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo. En caso de un radical "halógeno" significa un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

30 El término "halo" antes del nombre de un radical significa que este radical está parcialmente o completamente halogenado, es decir sustituido por F, Cl, Br o I en cualquier combinación. La expresión "alquilo (C₁-C₆)" significa un radical hidrocarburo saturado no ramificado o ramificado no cíclico que presenta 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono (indicados por un intervalo de átomos de C en el paréntesis), tal como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o terc-butilo. Lo mismo aplica a grupos alquilo en radicales compuestos tales como "alcoxialquilo". Radicales alquilo y también en grupos compuestos, a menos que se defina de otra forma, presenta preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono.

35 "Haloalquilo (C₁-C₆)" significa un grupo alquilo citado en la expresión "alquilo (C₁-C₆)" en la que uno o más átomos de hidrógeno son reemplazados por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes, tales como monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.

40 "[Alcoxi (C₁-C₄)]alquilo (C₁-C₆)" significa alquilo (C₁-C₆) que está sustituido por alcoxi (C₁-C₄). "Alcoxi (C₁-C₆)" significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbono presenta el significado dado en la expresión "alquilo (C₁-C₆)". "Haloalcoxi" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ o OCH₂CH₂Cl.

45 "Alquenilo (C₂-C₆)" significa una cadena de carbono no cíclica no ramificada o ramificada que presenta un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo establecido y que contiene al menos un enlace doble que puede estar localizado en cualquier posición del radical no saturado respectivo. "Alquenilo (C₂-C₆)" de acuerdo con lo anterior denota, por ejemplo, el vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o el grupo hexenilo. "Alquinilo (C₂-C₆)" significa una cadena de carbono no ramificada o ramificada no cíclica que presenta un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo establecido y que contiene un enlace triple que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquinilo (C₂-C₆)" de acuerdo con lo anterior denota, por ejemplo, el grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butenilo o 3-butenilo y clohexadienilo.

50

Un radical o puente hidrocarburo es un grupo monovalente o divalente, respectivamente, que comprende átomos de carbono y de hidrógeno, y que es un grupo acíclico o cíclico lineal o ramificado o un grupo que consiste en restos acíclicos y cíclicos, y cuyo grupo está saturado, parcialmente insaturado, completamente insaturado o aromático o cuyo grupo comprende dos o más de dichos restos estructurales unidos uno con otro.

Cicloalquilo es un sistema de anillo saturado carbocíclico que presenta preferiblemente de 3 a 8 átomos de carbono, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo. En el caso de cicloalquilo sustituido, se incluyen sistemas cíclicos con sustituyentes, cuando los sustituyentes están unidos por un enlace doble al radical cicloalquilo, por ejemplo, un grupo alquilideno tal como metilideno. En el caso de cicloalquilo sustituido, están también incluidos sistemas alifáticos policíclicos, por ejemplo, biciclo[1.1.0]butan-1-ilo, biciclo[1.1.0]butan-2-ilo, biciclo[2.1.0]pentan-1-ilo, biciclo[2.1.0]pentan-2-ilo, biciclo[2.1.0]pentan-5-ilo, adamantan-1-ilo y adamantan-2-ilo.

Cicloalquenilo es un sistema de anillo carbocíclico, no aromático, parcialmente insaturado que presenta preferiblemente de 4 a 8 átomos de carbono, por ejemplo, 1-ciclobutenilo, 2-ciclobutenilo, 1-ciclopentenilo, 2-ciclopentenilo, 3-ciclopentenilo, o 1-ciclohexenilo, 2-ciclohexenilo, 3-ciclohexenilo, 1,3-ciclohexadienilo o 1,4-ciclohexadienilo. En el caso de cicloalquenilo sustituido, las explicaciones para cicloalquilo sustituido aplican en correspondencia.

Haloalquil-, -alquenilo y -alquinilo son, respectivamente, alquilo, alquenilo y alquinilo sustituidos parcial o completamente por átomos de halógeno idénticos o diferentes, preferiblemente del grupo de flúor, cloro y bromo, de forma particular del grupo de flúor y cloro, por ejemplo, monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CF₃CF₂, CH₂FCHCl, CCl₃, CHCl₂, CH₂CH₂Cl; haloalcoxi es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ y OCH₂CH₂Cl; aplica lo mismo a haloalquenilo y otros radicales sustituidos con halógeno.

Arilo es un sistema aromático mono-, bi- o policíclico, por ejemplo, fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, pentalenilo, fluorenilo y similares, preferiblemente fenilo.

Un radical heterocíclico o anillo (heterociclilo) puede estar saturado, parcialmente insaturado, insaturado o ser heteroaromático; a menos que se defina de otra forma, contiene preferiblemente uno o más, de forma particular 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente del grupo de N, O y S; es preferiblemente un radical heterociclilo alifático que presenta de 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático que presenta de 5 a 6 átomos de anillo. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical heteroaromático o anillo (heteroarilo), por ejemplo, un sistema aromático mono-, bi- o policíclico en el que al menos un anillo contiene uno o más heteroátomos. Es preferiblemente un anillo heteroaromático que presenta un heteroátomo del grupo de N, O y S, por ejemplo, piridilo, pirrolilo, tienilo o furilo; es también preferiblemente un anillo heteroaromático correspondiente que presenta 2 ó 3 heteroátomos, por ejemplo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo. Es también preferiblemente un radical heterocíclico parcial o completamente hidrogenado que presenta un heteroátomo del grupo de N, O y S, por ejemplo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolinilo, pirrolidilo o piperidilo.

Es también preferiblemente un radical heterocíclico parcial o completamente hidrogenado que presenta 2 heteroátomos del grupo de N, O y S, por ejemplo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo.

Posibles sustituyentes para un radical heterocíclico sustituido incluyen los sustituyentes especificados a continuación, y adicionalmente también oxo. El grupo oxo puede también existir en los heteroátomos del anillo en distintos estados de oxidación, por ejemplo, en el caso de N y S.

Ejemplos preferidos de heterociclilo son un radical heterociclilo que presenta de 3 a 6 átomos de anillo del grupo de piridilo, tienilo, furilo, pirrolilo, oxiranilo, 2-oxetanilo, 3-oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), pirrolidilo, piperidilo, especialmente oxiranilo, 2-oxetanilo, 3-oxetanilo o oxolanilo, o es un radical heterocíclico que presenta dos o tres heteroátomos, por ejemplo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, pirazolilo, triazolilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo o morfolinilo.

Cuando una estructura base está sustituida "por no o más radicales" de una lista de radicales (= grupo) o un grupo de radicales definido genéricamente, esto incluye en cada caso sustitución simultánea con una pluralidad de radicales idénticos y/o estructuralmente diferentes.

Radicales sustituidos, tales como un alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, fenilo, bencilo, heterociclilo y heteroarilo sustituidos, son, por ejemplo, un radical sustituido derivado de la estructura base no sustituida, cuando los sustituyentes son, por ejemplo, uno o más, preferiblemente 1, 2 ó 3, radicales del grupo de halógeno, alcoxi, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, azido, alcocarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, mono- y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido tales como acilamino, mono- y dialquilamino, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y, en el caso de radicales cíclicos, también alquilo, haloalquilo, alquiltioalquilo, alquoxialquilo, mono- y dialquilaminoalquilo e hidroxialquilo opcionalmente sustituidos; en el término "radicales sustituidos", tales como alquilo sustituido etc., los sustituyentes incluyen, además de los radicales hidrocarburo saturados citados, radicales no saturados y aromáticos correspondientes, tales como alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, fenilo, fenoxi, etc. opcionalmente sustituidos.

En el caso de radicales cíclicos sustituidos que presentan restos alifáticos en el anillo, están también incluidos sistemas cíclicos con aquellos sustituyentes que están unidos al anillo por un enlace doble, por ejemplo, sustituidos por un grupo alquilideno tal como metilideno o etilideno.

Se debería observar que en el presente caso aquellos de los anteriores grupos que pueden reaccionar fácilmente en las condiciones de reacción con la cianoguanidina de fórmula (III) o con el grupo amino del compuesto (II) en el procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) no son preferidos o necesitan ser enmascarados por un "grupo protector" en caso que se tuviese que implementar tal grupo funcional.

- 5 Los sustituyentes citados a modo de ejemplo ("primer nivel de sustituyentes") pueden, cuando contienen restos hidrocarburo, estar además opcionalmente sustituidos ("segundo nivel de sustituyentes"), por ejemplo, con uno de los sustituyentes como se definieron para el primer nivel de sustituyentes. Son posibles de forma correspondiente más niveles de sustituyentes. El término "radical sustituido" incluye preferiblemente solo uno o dos niveles de sustituyentes.
- 10 Sustituyentes preferidos para los niveles de sustituyentes son, por ejemplo, amino, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, mercapto, carboxilo, carbonamida, SF₅, aminosulfonilo, alquilo, cicloalquilo, alquenilo, cicloalquenilo, alquínilo, monoalquilamino, dialquilamino, N-alcanoilamino, alcoxi, alquenilo, alquínilo, cicloalcoxi, cicloalquenilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquíniloxycarbonilo, ariloxycarbonilo, alcanoilo, alquenilcarbonilo, alquínilcarbonilo, arilcarbonilo, alquiltio, cicloalquiltio, alquéniltio, cicloalquéniltio, alquíniltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, monoalquilaminosulfonilo, dialquilaminosulfonilo, N-alquilaminocarbonilo, N,N-dialquil-aminocarbonilo, N-alcanoilaminocarbonilo, N-alcanoil-N-alquilaminocarbonilo, arilo, ariloxi, bencilo, benciloxi, benciltio, ariltio, arilamino y bencilamino.

- En el caso de radicales con átomos de carbono se da preferencia a aquellos que presentan de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, de forma particular 1 ó 2 átomos de carbono. En general
- 20 sustituyentes preferidos son aquellos del grupo de halógeno, por ejemplo, flúor y cloro, alquilo (C₁-C₄), preferiblemente metilo o etilo, haloalquilo (C₁-C₄), preferiblemente trifluorometilo, alcoxi (C₁-C₄), preferiblemente metoxi o etoxi, haloalcoxi (C₁-C₄), nitro y ciano. Se da preferencia a los sustituyentes metilo, metoxi, flúor y cloro.

- Amino sustituido, tal como amino mono- o disustituido, es un radical del grupo de los radicales amino sustituidos que están sustituidos en N, por ejemplo, con uno o dos radicales idénticos o diferentes del grupo de alquilo, alcoxi, acilo y arilo; preferiblemente mono- y dialquilamino, mono- y diarilamino, acilamino, N,N-diacilamino, N-alquil-N-arilamino, N-alquil-N-acilamino y N-heterociclos; se da preferencia a radicales alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; arilo es preferiblemente fenilo o fenilo sustituido; acilo es como se definió anteriormente, preferiblemente alcanoilo (C₁-C₄). Lo mismo aplica a hidroxilamino o hidrazina sustituidos.
- 25

- Fenilo opcionalmente sustituido es preferiblemente fenilo que está no sustituido o mono- o polisustituido, preferiblemente hasta trisustituido, con radicales idénticos o diferentes del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y nitro, por ejemplo, o-, m- y p-tolilo, dimetilfenilo, 2-, 3- y 4-clorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluoro- y -triclorofenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, o-, m- y p-metoxifenilo.
- 30

- La invención también proporciona todos los estereoisómeros que están comprendidos por la fórmula (I) y mezclas de los mismos. Tales compuestos de fórmula (I) contienen uno o más átomos de carbono asimétricos o incluso enlaces
- 35 dobles que no están indicados de forma específica en la fórmula general (I). Los posibles estereoisómeros definidos por su forma tridimensional específica, tales como enantiómeros, diastereómeros, isómeros Z y E, están todos comprendidos por la fórmula (I) y se pueden obtener de mezclas de los estereoisómeros por procedimientos personalizados o incluso prepararse mediante reacciones estereoselectivas en combinación con el uso de materiales de partida estereoquímicamente puros.

- 40 La expresión "uno o más radicales seleccionados seleccionados del grupo que consiste en" en la definición se tiene que entender que significa en cualquier caso uno o más radicales idénticos o diferentes seleccionados del grupo indicado de radicales, a menos que definan expresamente limitaciones específicas.

- Acilo es un radical de un ácido orgánico que surge en un sentido formal con la eliminación de un grupo hidroxilo en la función ácido, y el radical orgánico en el ácido puede unirse también a la función ácido mediante un heteroátomo.
- 45 Ejemplos de acilo son el radical -CO-R de un ácido carboxílico HO-CO-R y radicales de ácidos derivados del mismo, tales como aquellos de ácido tiocarboxílico, de forma opcional ácidos iminocarboxílicos sustituidos en N o el radical de monoésteres de ácido carbónico, ácido carbámico sustituido en N, ácidos sulfónicos, ácidos sulfínicos, ácidos de sulfonamida sustituidos en N, ácidos fosfóricos o ácidos fosfínicos.

- Acilo es, por ejemplo, formilo, alquilcarbonilo tal como [alquil (C₁-C₄)]carbonilo, fenilcarbonilo, alquiloalcoxycarbonilo, feniloalcoxycarbonilo, bencilalcoxycarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, N-alquil-1-iminoalquilo y otros radicales de ácidos orgánicos. Los radicales pueden estar sustituidos cada uno de ellos adicionalmente en el resto alquilo o fenilo, por
- 50 ejemplo, en el resto alquilo por uno o más radicales del grupo de halógeno, alcoxi, fenilo y fenoxi; ejemplos de sustituyentes en el resto fenilo son los sustituyentes ya citados anteriormente en general para fenilo sustituido.

- Acilo es preferiblemente un radical acilo en el sentido más concreto, es decir, un radical de un ácido orgánico en el que el grupo ácido está unido directamente con el átomo de carbono de un radical orgánico, por ejemplo, formilo, alquilcarbonilo tal como acetilo o [alquil (C₁-C₄)]carbonilo, fenilcarbonilo opcionalmente sustituido, tal como benzoilo, alquilsulfonilo, tal como metilsulfonilo, alquilsulfonilo, arilsulfonilo opcionalmente sustituido, tal como fenilsulfonilo o p-tolilsulfonilo y otros radicales de ácidos orgánicos.
- 55

- La invención también proporciona todos los estereoisómeros que están comprendidos por la fórmula (I) y mezclas de los mismos. Tales compuestos de fórmula (I) contienen uno o más átomos de carbono asimétricos o incluso enlaces dobles que no se indican de forma específica en la fórmula general (I). Los posibles estereoisómeros definidos por su forma tridimensional específica, tales como enantiómeros, diastereómeros, isómeros Z y E, están todos comprendidos por la fórmula (I) y se pueden obtener de mezclas de los estereoisómeros por procedimientos personalizados o incluso prepararse mediante reacciones estereoselectivas en combinación con el uso de materiales de partida estereoquímicamente puros.
- Compuestos de la fórmula (I) indicada de acuerdo con la invención en la que los radicales individuales tienen uno de los significados preferidos que ya se han indicado o se indicado a continuación en esta invención y de forma particular aquellos mostrados en los ejemplos de la tabla, o en particular aquellos en los que se combinan dos o más de los significados preferidos que ya se han indicado o que se indican a continuación, son de interés particular, principalmente debido a la facilidad de preparación o eficacia en el procedimiento de formación de los complejos de aluminio o en el procedimiento de formación de triazinas a partir de complejos de aluminio.
- Son de interés particular compuestos de fórmula (I) donde un radical seleccionado del grupo de radicales R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , X e Y se define preferiblemente como se indica a continuación.
- En las siguientes definiciones preferidas se entiende en general que donde no se definan específicamente símbolos para un grupo específico de compuestos estos se tienen que definir como se definen para los compuestos de fórmula (I) o la fórmula genérica respectiva o para compuestos preferidos de fórmula (I) o la fórmula preferida respectiva en la descripción.
- R^1 preferiblemente es alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), más preferiblemente alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o alquinilo (C_2-C_6),
- en el que cada uno de los seis radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas $-O-R^{1a}$, $-S-R^{1b}$, $-S(=O)-R^{1c}$, $-S(=O)_2-R^{1d}$, $-NR^{1e}R^{1f}$, $-C(=O)-NHR^{1g}$, $-C(=O)-NR^{1h}R^{1i}$, $-NHC(=O)-NR^{1j}R^{1k}$ y A^{1a} ,
- más preferiblemente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo y radicales de fórmulas $-O-R^{1a}$, $-S-R^{1b}$, $-S(=O)-R^{1c}$, $-S(=O)_2-R^{1d}$, $-NR^{1e}R^{1f}$ y A^{1a} ,
- más preferiblemente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo y radicales de fórmula $-O-R^{1a}$ y A^{1a} ,
- en la que R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^{1e} , R^{1f} , R^{1g} , R^{1h} , R^{1i} , R^{1j} , y R^{1k} , independientemente unos de otros, son alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), o un radical de fórmula A^{1b} , preferiblemente son alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_6), o un radical de fórmula A^{1b} ,
- más preferiblemente son alquilo (C_1-C_4) o un radical de fórmula A^{1b} ,
- o es un grupo de fórmula A^1 o B^1 , preferiblemente de fórmula A^1 ,
- o R^1 y R^2 junto con el átomo de N unido al otro forman un anillo N-heterocíclico que presenta 5 ó 6 átomos de anillo y de forma opcional presenta 1, 2 ó 3 heteroátomos adicionales seleccionados del grupo que consiste en N, O y S y que están no sustituido o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino, y oxo,
- preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo y oxo
- más preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo y oxo
- A^1 , A^{1a} y A^{1b} , independientemente uno de otro, son cicloalquilo (C_3-C_9), cicloalquenilo (C_4-C_9), cicloalquinilo (C_5-C_9), arilo o heterociclilo como un resto básico, en el que el resto cíclico básico está no sustituido o sustituido, preferiblemente
- (a) está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo

(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino, y en el caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo,

más preferiblemente no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, sulfo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo y haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, más preferiblemente no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, más preferiblemente está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio y alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, o

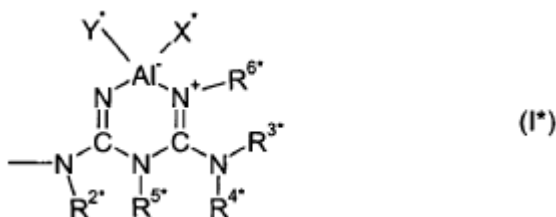
(b) sustituido por o sustituido adicionalmente con uno o más de los sustituyentes citados en (a) por un puente unido geminalmente (una posición 1,1), vicinalmente (una posición 1,2) o en una posición 1,3 en el resto cíclico básico formando de este modo otro anillo carbocíclico o heterocíclico junto con la parte del resto cíclico básico entre los átomos unidos al puente, preferiblemente mediante un puente unido en una posición vicinal del resto cíclico básico formando así un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado con el resto cíclico básico, en el que el anillo carbocíclico o heterocíclico formado está saturado, parcialmente insaturado, insaturado que presenta de 3 a 9 átomos de anillo o es aromático o heteroaromático que presenta de 5 a 6 átomos de anillo y en el que el puente está no sustituido o sustituido adicionalmente, en el que preferiblemente el puente que forma un anillo está no sustituido o sustituido adicionalmente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino, y, en el caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o está benzocondensado adicionalmente en el que el anillo de benceno condensado adicional está no sustituido o sustituido adicionalmente con uno o más radicales como se definen para la sustitución del puente que está benzocondensado,

más preferiblemente el puente que forma un anillo está adicionalmente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, sulfo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo y haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo,

más preferiblemente el puente que forma un anillo está adicionalmente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo y haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo,

más preferiblemente el puente que forma un anillo está adicionalmente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio y alquil (C₁-C₄)-sulfonilo,

B¹ es un grupo como se define para R¹ unido adicionalmente al grupo amino del grupo de fórmula (I*),



en la que R^{2*} , R^{3*} , R^{4*} , R^{5*} , R^{6*} , X^* e Y son independientemente como se definen en la fórmula (I) para R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X e Y , respectivamente.

Ejemplos de R^1 son alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), más preferiblemente alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o alquinilo (C_2-C_6), en el que cada uno de los seis radicales recién citados está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino, cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_5-C_6), fenilo, naftilo, heterociclilo, heterociclilo benzocondensado, benzo-cicloalquilo (C_5-C_6), benzo-cicloalquenilo (C_5-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_5), benzo-cicloalcoxi (C_5-C_6), cicloalquenil (C_5-C_6)-oxi, benzo-cicloalquenil (C_5-C_6)-oxi, fenoxi, naftoxi, feniltio, heterociciloxi, heterociciloxi benzocondensado, heterociciltio, heterociciltio benzocondensado,

en el que cada uno de los 19 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino y, en el caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o son cicloalquilo (C_3-C_6), benzo-cicloalquilo (C_5-C_6), cicloalquenilo (C_5-C_6), benzo cicloalquenilo (C_5-C_6), fenilo, naftilo, heterociclilo, heterociclilo benzocondensado,

en el que cada uno de los 8 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino y, en el caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo.

“Heterociclilo” para los anteriores radicales o sustituyentes es preferiblemente un anillo heterocíclico saturado, parcialmente saturado, insaturado o heteroaromático que presenta de 3 a 9 átomos de anillo, preferiblemente 5 ó 6 átomos de anillo en caso de un anillo saturado o que presenta 5 a 9, preferiblemente 5 ó 6 átomos de anillo en caso de anillo parcialmente saturado, insaturado o heteroaromático, preferiblemente un anillo que presenta 1, 2, 3 ó 4 átomos de heteroanillo seleccionados del grupo que consiste en N, O y S.

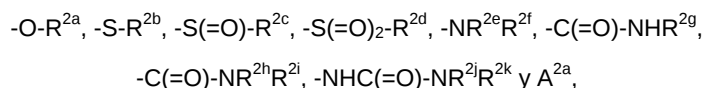
Preferiblemente heterociclilo opcionalmente sustituido es heterociclilo o heteroarilo saturado o derivados benzocondensados de los mismos que pueden estar adicionalmente sustituidos.

Heteroarilo preferiblemente es: pirrol, imidazol, triazol, tetrazol, tiofeno, tiazol, tiadiazol, oxazol, oxadiazol, piridina, pirimidina, piperazina, triazina, tetrazina, derivados benzocondensados de los mismos y combinaciones bicíclicas de los mismos. Preferiblemente R^1 es alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), fenilo, naftilo, fenil-alquilo (C_1-C_6), tal como bencilo o fenetilo, alquenilo (C_2-C_6), fenil-alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), fenil-alquinilo (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6), benzo-cicloalquilo (C_5-C_6), tal como tetrahidronaftilo, indanilo, indenilo, fluorenilo, heteroarilo, en los que los radicales están no sustituidos o sustituidos en el resto cíclico, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales citados como sustituyentes para A^1 anteriormente.

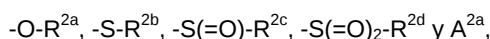
Preferiblemente R^1 y R^2 junto con el átomo de N unido al otro son un anillo heterocíclico saturado que presenta 5 ó 6 átomos de anillo y pueden tener 1 ó 2 heteroátomos adicionales seleccionados del grupo que consiste en N, O y S y que está no sustituido o sustituido, por ejemplo, pirrolidino, morfolino, piperidino, dihidroindolino, dihidroisindolino, tetrahidroquinolino, tetrahidroisoquinolino, que pueden estar todos ellos sustituidos, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales citados como sustituyentes para A^1 anteriormente.

Preferiblemente R^2 es H, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), más preferiblemente H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o alquinilo (C_2-C_6), más preferiblemente H, alquilo (C_1-C_4), en particular H,

en el que cada uno de los radicales que contienen carbono está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas



más preferiblemente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo y radicales de fórmulas



más preferiblemente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo y radicales de fórmula $-\text{O}-\text{R}^{2a}$ y A^{2a} ,

5 en las que $\text{R}^{2a}, \text{R}^{2b}, \text{R}^{2c}, \text{R}^{2d}, \text{R}^{2e}, \text{R}^{2f}, \text{R}^{2g}, \text{R}^{2h}, \text{R}^{2i}, \text{R}^{2j}$, y R^{2k} independientemente unos de otros, son alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) o un radical de fórmula A^{2b} ,

preferiblemente alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$) o un radical de fórmula A^{2b} ,

más preferiblemente son alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), o un radical de fórmula A^{2b} ,

o es un grupo de fórmula A^2 ,

10 en el que $\text{A}^2, \text{A}^{2a}$ y A^{2b} , independientemente unos de otros, son como se definen para $\text{A}^1, \text{A}^{1a}$ y A^{1b} , anteriormente, preferiblemente en las que $\text{A}^2, \text{A}^{2a}$ y A^{2b} independientemente uno de otro, son cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), fenilo, heterocíclico, en los que cada uno de los 3 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico, preferiblemente está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamilo, sulfo, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfinilo, 15 haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfinilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfinilo, haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, di[(alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$))-amino, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-amino-carbonilo, di[(alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$))-amino-carbonilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-amino-carbonilamino y di[(alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$))-amino-carbonilamino, y, en caso de heterocíclico, también oxo unido a átomos de heteroanillo de N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo,

20 más preferiblemente está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, sulfo, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-tio, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo, haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo y haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo,

25 más preferiblemente está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-tio, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo y haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo,

más preferiblemente está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-tio y alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-sulfinilo,

30 o R^2 junto con R^1 y el átomo de N unido a ellos son como se define para NR^1R^2 anteriormente.

Ejemplos de R^2 son H o radicales como se definen preferiblemente para R^1 , de forma particular H, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_4$) o alquino ($\text{C}_2\text{-C}_4$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), fenilo, naftilo, fenil-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), tales como bencilo o fenetilo, o cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), en el que cada uno de los 6 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales como se definen para 35 sustituyentes en los grupos cíclicos $\text{A}^2, \text{A}^{2a}$ o A^{2b} .

$\text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5$ y R^6 , independientemente unos de otros y de R^1 y R^2 , son preferiblemente como se definen para R^2 o preferiblemente como se definen para R^2 .

Más preferiblemente $\text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5$ y R^6 , independientemente unos de otros, son H o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), de forma particular H.

40 R^3 y R^4 , junto con el átomo de N pueden formar un anillo y luego, independientemente de NR^1R^2 son un grupo cíclico como se definió anteriormente para R^1 y R^2 junto con el átomo de N que forma un anillo.

X e Y, independientemente uno de otro, se seleccionan cada uno preferiblemente del grupo que consiste en

(i) amino,

45 (ii) un grupo de fórmula NR^7R^8 en la que R^7 es un radical seleccionado del grupo que consiste en radicales como se definen para e independientemente de R^1 , y en la que R^8 es un radical seleccionado del grupo que consiste en radicales como se definen para e independientemente de R^2 , preferiblemente un grupo de fórmula NR^7R^8 que se define como el grupo NR^1R^2 en la fórmula (I),

(iii) hidroxilo,

(iv) alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$) y alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-tio,

(v) alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄) y alquil (C₁-C₄)-tio, en las que cada uno de los últimos 4 radicales está sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆),

5 en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), arilo y ariloxi, preferiblemente fenilo o fenoxi,

10 en los que cada uno de los 4 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

15 (vi) cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄),

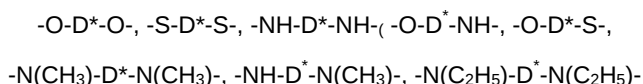
20 (vii) ariloxi, preferiblemente fenoxi, en el que cada uno de los dos radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

y

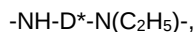
25 (viii) aciloxi, aciltio o acilamino, preferiblemente aciloxi, en los que los cuatro grupos recién citados que tienen de 1 a 12 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 8 átomos de carbono, y en el que acilo en cada grupo es preferiblemente formilo, alquil (C₁-C₆)-carbonilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo o arilsulfonilo opcionalmente sustituido, más preferiblemente acilo es acetilo, n- o i-propionilo, n-, iso-, sec- o terc-butilcarbonilo, o metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, n-butilsulfonilo o fenilsulfonilo, estando este último no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄) y alquil (C₁-C₄)-tio, seleccionados preferiblemente del grupo que consiste en metilo y etilo,

más preferiblemente X e Y se seleccionan cada uno de los grupos (ii), (iv), (v), (vi), (vii) y (viii) anteriores, más preferiblemente de los grupos (ii), (iv) y (v) anteriores, o

35 X e Y juntos son un grupo divalente de fórmula



o



40 en las que D* en cada uno de los 9 grupos divalentes recién citados es un puente alquileno lineal, un puente alquenileno (C₂-C₁₀) lineal, un puente alquilileno (C₂-C₁₀) lineal, un puente cicloalquileno (C₃-C₉), un puente fenileno o un puente que consiste en una combinación de dos o más de dichos restos acíclicos y cíclicos lineales que presentan en total de 4 a 18 átomos de carbono, en el que el puente en cada caso está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

o

50 X es un radical como se definió anteriormente e Y es un ligando orgánico basado en un compuesto de fórmula Y'-H, Y'-R^L o R^L-O-D**-O-R^{LL}, R^L-S-D**-S-R^{LL}, R^L-NH-D**-NH-R^{LL}, R^L-O-D**-NH-R^{LL}, R^L-O-D**-S-R^{LL}, R^L-N(CH₃)-D**-N(CH₃)-R^{LL}, R^L-NH-D**-N(CH₃)-R^{LL}, R^L-N(C₂H₅)-D**-N(C₂H₅)-R^{LL} o R^L-NH-D**-N(C₂H₅)-R^{LL}, en la que D** en cada uno de los 9 compuestos recién citados es un grupo divalente como se definió para el grupo D* anteriormente, Y' es un radical como se definió para Y, y cada uno de R^L y R^{LL} es un grupo radical seleccionado del grupo que consiste

en alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alquilo (C₁-C₆), o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en el que el ligando orgánico está coordinado con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre de un heteroátomo contenido en el mismo y seleccionado del grupo que consiste en N, O y S,

o

- 5 X e Y juntos son un radical de fórmula -O-D^{**}-O-R^{LLL}, -S-D^{**}-S-R^{LLL}, -NH-D^{**}-NH-R^{LLL}, -O-D^{**}-NH-R^{LLL}, -NH-D^{**}-O-R^{LLL}, -O-D^{**}-S-R^{LLL}, -S-D^{**}-O-R^{LLL}, -N(CH₃)-D^{**}-N(CH₃)-R^{LLL}, -NH-D^{**}-N(CH₃)-R^{LLL}, -N(CH₃)-D^{**}-NH-R^{LLL}, -N(C₂H₅)-D^{**}-N(C₂H₅)-R^{LLL}, -NH-D^{**}-N(C₂H₅)-R^{LLL} o -N(C₂H₅)-D^{**}-NH-R^{LLL}, en las que D^{*} en los 13 radicales recién citados es como se definió anteriormente, y R^{LLL} es un radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄), hidroxi-alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), y en los que el radical está coordinado adicionalmente con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre localizado en un heteroátomo contenido en el radical (posición representada por Y), preferiblemente localizado en el heteroátomo del grupo R^{LLL} en el grupo divalente.

Son más preferidos compuestos (I) en los que X e Y, independientemente uno de otro, se seleccionan cada uno del grupo que consiste en

(i) amino,

- 15 (ii) un grupo de fórmula NR⁷R⁸ que se define como el grupo NR¹R² en la fórmula (I),

(iii) hidroxi,

- (iv) alcoxi (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), preferiblemente alcoxi (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄) en el que el átomo de O del grupo alcoxi unido directamente al átomo de aluminio está alejado dos átomos de carbono del átomo de O del grupo alcoxi terminal; más preferiblemente isopropoxi, 2-butoxi, 2-metoxi-etoxi, 2-etoxi-etoxi, 2-metoxi-1-metil-etoxi, 2-etoxi-1-metil-etoxi,

- (v) alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄) y alquil (C₁-C₄)-tio, en las que cada uno de los últimos 4 radicales está sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄),

- (vi) cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄),

y

- 30 (vii) fenoxi que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino],

y

- 35 (viii) aciloxi, aciltio o acilamino, preferiblemente aciloxi, en los que los cuatro grupos recién citados que tienen de 1 a 12 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 8 átomos de carbono, y en el que acilo en cada grupo preferiblemente es formilo, alquil (C₁-C₆)-carbonilo o alquil (C₁-C₆)-sulfonilo o fenilsulfonilo, estando este último no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄), más preferiblemente acilo es acetilo, n- o i-propionilo, n-, iso-, sec- o terc-butilcarbonilo, o metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, n-butilsulfonilo, fenilsulfonilo, o-, m- o p-tolilsulfonilo, más preferiblemente X e Y se seleccionan cada uno de los grupos (ii), (iv), (v), (vi), (vii) y (viii) anteriores, más preferiblemente de los grupos (ii), (iv) y (v) anteriores, o

- 45 X e Y juntos son un grupo divalente de fórmulas -O-D^{*}-O-, -S-D^{*}-S-, -NH-D^{*}-NH-, -O-D^{*}-NH-, en las que D^{*} en cada uno de los 4 grupos divalentes recién citados es un puente alquilenilo lineal, un puente alquilenilo (C₂-C₆) lineal, un puente alquilenilo (C₂-C₆) lineal, un puente cicloalquilenilo (C₃-C₆), un puente 1,2-fenilenilo o un puente que consiste en una combinación de dos o más de dichos restos acíclicos y cíclicos lineales que presentan en total de 4 a 12 átomos de carbono, en el que el puente en cada caso está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxi, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-sulfonilo y di[(alquil (C₁-C₄))-amino];

50

o

X es un radical como se definió anteriormente e Y es un ligando orgánico basado en un compuesto de fórmulas Y'-H, Y'-R^L o R^L-O-D^{**}-O-R^{LL}, R^L-S-D^{**}-S-R^{LL}, R^L-NH-D^{**}-NH-R^{LL}, R^L-O-D^{**}-NH-R^{LL}, R^L-O-D^{**}-S-R^{LL}, R^L-N(CH₃)-D^{**}-N(CH₃)-R^{LL}, R^L-NH-D^{**}-N(CH₃)-R^{LL}, R^L-N(C₂H₅)-D^{**}-N(C₂H₅)-R^{LL} o R^L-NH-D^{**}-N(C₂H₅)-R^{LL}, en

la que D** en cada uno de los 9 compuestos recién citados es un grupo divalente como se definió para el grupo D* anteriormente, Y' es un radical como se definió para Y, y cada uno de R^L y R^{LL} es un grupo radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alquilo (C₁-C₆), o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en el que el ligando orgánico está coordinado con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre de un heteroátomo contenido en el mismo y seleccionado del grupo que consiste en N, O y S,

o

X e Y juntos son un radical de fórmula O-D**-O-R^{LLL}, -S-D**-S-R^{LLL}, -NH-D**-NH-R^{LLL}, -O-D**-NH-R^{LLL}, -NH-D**-O-R^{LLL}, -O-D**-S-R^{LLL}, -S-D**-O-R^{LLL}, -N(CH₃)-D**-N(CH₃)-R^{LLL}, -NH-D**-N(CH₃)-R^{LLL}, -N(CH₃)-D**-NH-R^{LLL}, -N(C₂H₅)-D**-N(C₂H₅)-R^{LLL}, -NH-D**-N(C₂H₅)-R^{LLL} o -N(C₂H₅)-D**-NH-R^{LLL}, en las que D* en los 13 radicales recién citados es como se definió anteriormente, y R^{LLL} es un radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄), hidroxi-alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), y en los que el radical está coordinado adicionalmente con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre localizado en un heteroátomo contenido en el radical (posición representada por Y), preferiblemente localizado en el heteroátomo del grupo R^{LLL} en el grupo divalente.

Se prefieren adicionalmente compuestos (I) en los que

R¹, X e Y son como se definieron anteriormente,

R² es hidrógeno,

R³ es hidrógeno,

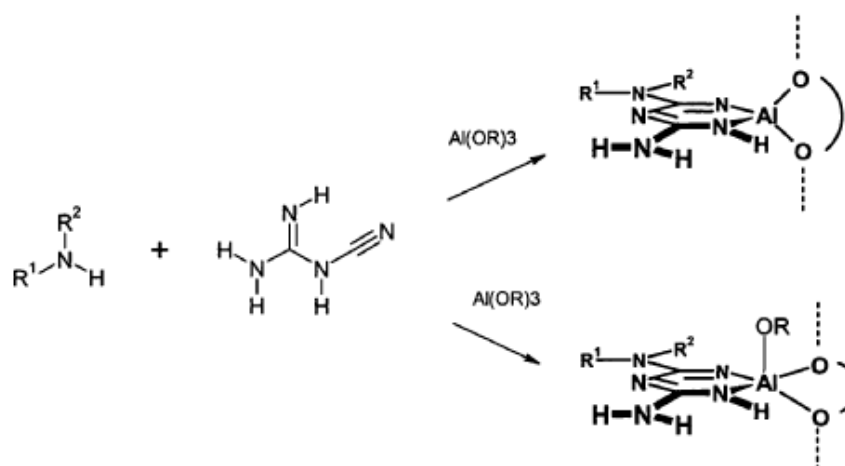
R⁴ es hidrógeno,

R⁵ es hidrógeno y

R⁶ es hidrógeno.

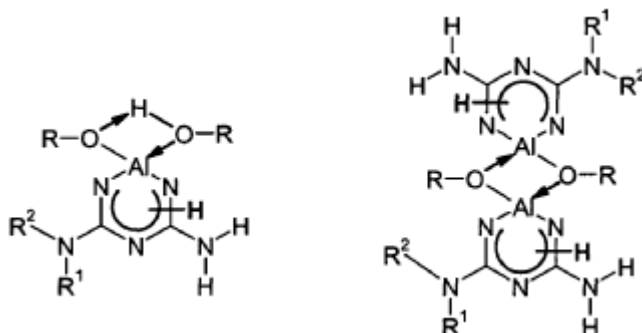
A partir de estudios de RMN Al²⁷ se ha demostrado que la estructura estereoquímica del complejo de aluminio depende de los ligandos X e Y y ligandos presentes en soluciones de compuestos (I), que en el caso de que X e Y u otros ligandos con átomos de oxígeno están unidos al átomo de aluminio, ese átomo de aluminio está tetra-coordinado tetrahédricamente o también penta-coordinado, como se conoce de otros casos en la química del aluminio (véase el esquema 2, que muestra el caso de R³ a R⁶ siendo cada uno H).

Esquema 2:



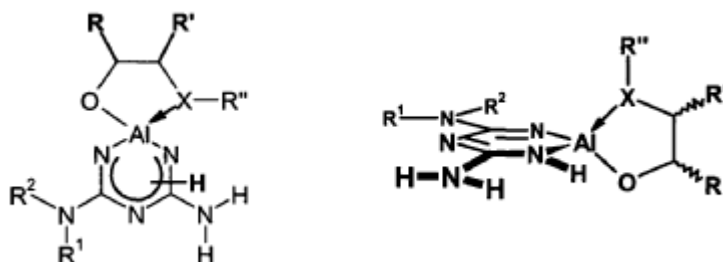
En disolventes de mono-coordinación tales como alcoholes simples, por ejemplo: metanol, etanol, isopropanol, 1-butanol, 2-butanol, etc. el complejo puede ser de forma variable monomérico o dimérico por naturaleza, en función de la concentración de complejo en solución o de si el complejo está en forma de sólido (esquema 3, que muestra el caso de R³ a R⁶ siendo cada uno H):

Esquema 3:



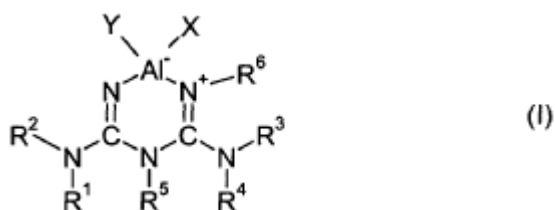
En presencia de disolventes más complejos que son capaces de ofrecer un segundo sitio de coordinación, por ejemplo, alcoxialcoholes, el complejo se ha demostrado (por ejemplo por RMN ^1H e IR) que es monomérico (esquema 4), y por tanto es quiral en el centro de aluminio. Por ejemplo, en presencia de 2-etoxietanol el complejo de aluminio formado se muestra en el esquema 4, en el que $\text{X} = \text{O}$, $\text{R}'' = \text{Et}$ y $\text{R}' = \text{R} = \text{H}$ y 1-metoxi-2-propanol $\text{X} = \text{O}$, $\text{R}'' = \text{R} = \text{Me}$, $\text{R}'' = \text{H}$, y R^4 a R^6 en la fórmula (I) son H (sólo se muestra un diastereoisómero en el centro de aluminio).

Esquema 4:



Cada estructura mostrada en los esquemas 1 a 4 es una representación gráfica no limitativa de todos los isómeros tautoméricos de esa estructura. Adicionalmente si el disolvente de coordinación es quiral, entonces se pueden formar mezclas diastereoméricas de complejos en relaciones variables.

Otro objeto de la invención es un procedimiento para la preparación de complejos de bisguanidina-aluminio de fórmula (I) o sales de los mismos.

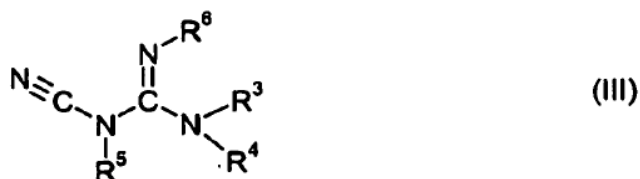


en la que R^1 a R^6 y X y Y son como se definieron anteriormente,

caracterizado porque un compuesto (una amina) de fórmula (II) o una sal del mismo,



en la que R^1 y R^2 se definen como en el compuesto de fórmula (I) que se tiene que preparar, se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (III) o sales del mismo,



en la que R^3 , R^4 , R^5 y R^6 se definen como en el compuesto de fórmula (I) que se va a preparar, y una fuente de aluminio (III), opcionalmente, en presencia de un aditivo o disolvente prótico seleccionado del grupo que consiste en alcoholes o aminas, preferiblemente una fuente de aluminio (III) seleccionada de

- 5 (i) sales de aluminio de fórmula (IV),



en la que

X e Y son como se definieron en el compuesto de fórmula (I) que se va a preparar, y Z, independientemente de X es un grupo saliente seleccionado del grupo de radicales como se definieron para X ó Y, o

- 10 (ii) sales de aluminio de fórmula (IV'),



en la que

- 15 X', Y' y Z' se seleccionan cada uno del grupo que consiste en radicales como se definieron para X, Y o Z, respectivamente y radicales que generan dicho grupo X, Y o Z, respectivamente en presencia de un aditivo o disolvente prótico X-H, Y-H o Z-H, respectivamente, con la condición de que 1, 2 ó 3 de los radicales X', Y' y Z' se seleccionan de dichos radicales que generan radicales X, Y y Z, respectivamente,

en combinación con un aditivo o disolvente prótico X-H, Y-H o Z-H en las que cada uno de X, Y y Z se definen como se describe para X e Y en fórmula (I), y sales de adición de los mismos.

- 20 Preferiblemente las aminas de fórmula (II) son monoaminas. Si las aminas de fórmula (II) contienen otro grupo amino primario o secundario este grupo puede reaccionar como el primer grupo amino con el compuesto de fórmula (III). En tal caso, preferiblemente en caso de una diamina con dos grupos amino primarios y cuando ambos grupos amino reaccionan, se obtiene el compuesto de fórmula (I) donde R^1 es un grupo de fórmula (B^1). Se seleccionan radiales adecuados X, Y y Z en compuestos (IV) del grupo que consiste en radicales (i), (ii), (iii), (iv), (v), (vi) y (vii) indicados anteriormente para X e Y de los compuestos de fórmula (I).

- 25 Radicales adecuados X', Y' y Z' en la fórmula (IV) que generan un radical X, Y y Z en presencia de un aditivo o disolvente prótico son H, halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_{18}$) que está no sustituido o sustituido, preferiblemente está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), arilo y arilo sustituido, o es arilo que está no sustituido o sustituido, preferiblemente que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), y el aditivo o disolvente prótico se selecciona del tipo X-H, Y-H o Z-H donde X, Y y Z son como se definieron para X o Y, o preferiblemente como se definieron para X o Y, en el compuesto (I). Tales aditivos próticos son del tipo de HO-alquilo, HO-arilo, HO-alquilarilo, NH_3 o HNR^1R^2 para generar grupos X, Y y Z del tipo -O-alquilo, -O-arilo, -O-alquilarilo, -amino o $\text{-NR}^1\text{R}^2$, respectivamente.

- 35 Radicales adecuados X', Y' y Z' en la fórmula (IV') que generan un radical X, Y y Z en presencia de un aditivo o disolvente prótico son preferiblemente H, halógeno, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) que está no sustituido o sustituido, preferiblemente está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), fenilo y fenilo sustituido (preferiblemente fenilo sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), o son fenilo que está no sustituido o sustituido, preferiblemente que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$).

Radicales adecuados X', Y' y Z' en la fórmula (IV') que generan un radical X, Y y Z en presencia de un aditivo o disolvente prótico son también aquellos seleccionados del grupo que consiste en radicales (i), (ii), (iii), (iv), (v), (vi) y

(vii) citados anteriormente para X e Y de los compuestos de fórmula (I) si estos se usan en combinación con un aditivo o disolvente prótico del tipo X-H, Y-H o Z-H si el grupo X, Y y Z en el aditivo o disolvente prótico es más nucleófilo que X', Y' o Z' en el compuesto de fórmula (IV') o si el aditivo o disolvente prótico está presente en un gran exceso de modo que tenga lugar un intercambio de ligandos.

- 5 Compuestos adecuados de fórmula (IV) son trimetóxido de aluminio $[\text{Al}(\text{OCH}_3)_3]$, trietóxido de aluminio $[\text{Al}(\text{OC}_2\text{H}_5)_3]$, tri(n-propóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-n-C}_3\text{H}_7)_3]$, tri(i-propóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-i-C}_3\text{H}_7)_3]$, tri(n-butóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-n-C}_4\text{H}_9)_3]$, tri(sec-butóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-Sec-C}_4\text{H}_9)_3]$, tri(i-butóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-i-C}_4\text{H}_9)_3]$, tri(terc-butóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-terc-C}_4\text{H}_9)_3]$, tri(2-metoxi-etóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-CH}_2\text{CH}_2\text{-O-CH}_3)_3]$, tri(2-etoxi-etóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-CH}_2\text{CH}_2\text{-O-C}_2\text{H}_5)_3]$, tri(2-metoxi-1-metil-etóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{-O-CH}_3)_3]$, tri(2-etoxi-1-metil-etóxido) de aluminio $[\text{Al}(\text{O-CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{-O-C}_2\text{H}_5)_3]$, o compuestos de aluminio con radicales mixtos tales como $\text{Al}(\text{OCH}_3)_2(\text{OC}_2\text{H}_5)$, $\text{Al}(\text{OCH}_3)(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$, $\text{Al}(\text{OCH}_3)(\text{O-n-C}_3\text{H}_7)_2$, $\text{Al}(\text{OCH}_3)_2(\text{O-n-C}_3\text{H}_7)$, $\text{Al}(\text{OC}_2\text{H}_5)(\text{O-n-C}_3\text{H}_7)_2$, $\text{Al}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2(\text{O-n-C}_3\text{H}_7)$, $\text{Al}(\text{OCH}_3)(\text{O-i-C}_3\text{H}_7)_2$, $\text{Al}(\text{OCH}_3)_2(\text{O-i-C}_3\text{H}_7)$, $\text{Al}(\text{OC}_2\text{H}_5)(\text{O-i-C}_3\text{H}_7)_2$, $\text{Al}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2(\text{O-i-C}_3\text{H}_7)$.

- 15 Los compuestos (IV) anteriores son también fuentes de aluminio (III) adecuadas de fórmula (IV) en presencia de un aditivo o disolvente prótico seleccionado de alcoholes y/o aminas del tipo X-H, Y-H o Z-H.

- 20 De forma adicional compuestos adecuados (IV') que se usan en presencia de un aditivo o disolvente prótico seleccionados de alcoholes y/o aminas del tipo X-H, Y-H o Z-H son compuestos de aluminio tales como trimetilaluminio $[\text{Al}(\text{CH}_3)_3]$, trietilaluminio $[\text{Al}(\text{C}_2\text{H}_5)_3]$, trifenilaluminio $[\text{Al}(\text{C}_6\text{H}_5)_3]$, hidruros de aluminio y sales de adición de ácido de los mismos tales como hidruro de aluminio $[\text{AlH}_3]$, hidruro de litio y aluminio $[\text{LiAlH}_4]$, hidruros de alquilaluminio tales como $(\text{CH}_3)\text{AlH}_2$, $(\text{CH}_3)_2\text{AlH}$, $(\text{C}_2\text{H}_5)\text{AlH}_2$, $(\text{C}_2\text{H}_5)_2\text{AlH}$, $(\text{n-C}_3\text{H}_7)\text{AlH}_2$, $(\text{n-C}_3\text{H}_7)_2\text{AlH}$, $(\text{i-C}_3\text{H}_7)\text{AlH}_2$, $(\text{i-C}_3\text{H}_7)_2\text{AlH}$, $(\text{n-C}_4\text{H}_9)\text{AlH}_2$, $(\text{n-C}_4\text{H}_9)_2\text{AlH}$, $(\text{Sec-C}_4\text{H}_9)\text{AlH}_2$, $(\text{Sec-C}_4\text{H}_9)_2\text{AlH}$, $(\text{J-C}_4\text{H}_9)\text{AlH}_2$, $(\text{i-C}_4\text{H}_9)_2\text{AlH}$ [DIBAL].

La reacción se puede llevar a cabo también en masa o en presencia de un disolvente o mezclas de disolventes. Como se citó anteriormente algunos de los disolventes pueden funcionar como un reactante para formar un ligando del complejo de aluminio.

- 25 Disolventes adecuados son, por ejemplo, pero sin limitarse a estos:

disolventes orgánicos seleccionados del grupo que consiste en la clase química de

- éteres, tal como dialquiléteres (por ejemplo, dietiléter) o éteres alifáticos cíclicos (por ejemplo, tetrahydrofurano),
- hidrocarburos alifáticos saturados o insaturados, que pueden estar no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, nitro y alcoxi, preferiblemente alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), es decir, disolventes tales como alcanos, alquenos, haloalcanos, nitroalcanos,
- hidrocarburos aromáticos, que pueden estar no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en alquilo (preferiblemente alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alcoxi (preferiblemente alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)), halógeno y nitro, es decir, disolventes tales como aromatos, alquilaromatos, haloaromatos, nitroaromatos, alcoxiaromatos,
- alcoholes, de forma particular alcoholes alifáticos, tales como alcanoles, ω -dioles o ω -polioles, que pueden estar no sustituidos o sustituidos, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales del grupo que consiste en alcoxi (preferiblemente alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$), halógeno, nitro, amino, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-amino, y di-[alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)]-amino,
- heteroaromatos, tales como compuestos heteroaromáticos que presentan 5 ó 6 átomos de anillo y 1 ó 2 heteroátomos, de forma particular 1 heteroátomo, seleccionados del grupo que consiste en N, O y S, tales como piridina o tiofeno,
- sulfonas, tales como sulfolano,
- sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y
- aminas, tales como monoaminas, diaminas o poliaminas.

Se prefieren alcoholes o se prefieren mezclas que incluyen un alcohol o alcohalcohol, tales como, propanol, isopropanol, isobutanol, ciclohexanol, 2-etoxi-etanol-1-ol, 2-metoxi-etanol-1-ol, 2-isopropoxi-etanol-1-ol, 2-metoxi-1-metil-etanol-1-ol (= 1-metoxi-isopropanol), 2-etoxi-1-metil-etanol-1-ol (= 1-etoxi-isopropanol). Estos disolventes pueden funcionar también como aditivos/disolventes próticos que determinan los ligandos del complejo de aluminio.

- 50 El procedimiento de formación de complejo se puede llevar a cabo a temperaturas relativamente moderadas tales como entre 50°C y 140°C y preferiblemente entre 70°C y 130°C y especialmente entre 90°C y 120°C .

La formación de complejo se lleva a cabo preferiblemente con 0,1 a 10,0 equivalentes de cianoguanidina de fórmula (III), más preferiblemente con 1,0 a 3,0 equivalentes de cianoguanidina de fórmula (III), más preferiblemente con 1,0 a 2,0 equivalentes de la cianoguanidina y especialmente con 1,0 a 1,6 equivalentes de la cianoguanidina, en base a 1 equivalente de compuesto (II) (amina) o sal del mismo.

- 5 La formación de complejo se lleva a cabo preferiblemente con 0,1 a 10,0 equivalentes del reactivo de aluminio de fórmula (IV), más preferiblemente con 1,0 a 3,0 equivalentes del reactivo de aluminio de fórmula (IV), más preferiblemente con 1,0 a 2,0 equivalentes del reactivo de aluminio y especialmente con 1,0 a 1,6 equivalentes del reactivo de aluminio, en base a 1 equivalente de compuesto (II) o sal del mismo.

- 10 Ya es conocido de Anorg. Chemie, Org. Chemie, Biochem, Biophys., Biol, 347, 1974 que el complejo de biguanidina de aluminio no sustituido se puede preparar a partir de cloruro de aluminio (AlCl_3) y biguanidina ($\text{C}_2\text{N}_5\text{H}_7$). La preparación de complejos sustituidos no hace mucho tiempo que se conoce.

Los compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos (de forma abreviada "compuestos (I)") son complejos de aluminio de biguanidas y son adecuados como intermedios para la preparación de productos que de otro modo se pueden preparar también mediante reacción de las respectivas biguanidas libres.

- 15 Los compuestos (I) son preferiblemente adecuados para la preparación de compuestos heterocíclicos, cuando el átomo de aluminio está reemplazado con un átomo de carbono opcionalmente sustituido o derivados heteroaromáticos del mismo, tales como s-triazinas.

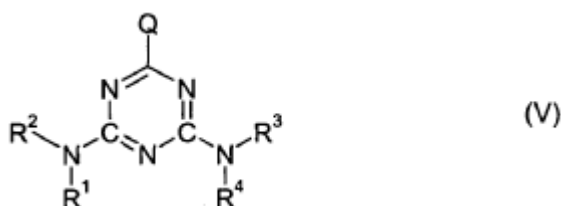
- 20 Otro objeto de la invención es por tanto el uso de compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos para la preparación de compuestos heterocíclicos que corresponden a la fórmula (I); en los que el grupo aluminio Al(X)(Y) está reemplazado con un átomo de carbono opcionalmente sustituido o derivados de s-triazina de los mismos.

- 25 Por ejemplo, estos últimos compuestos heterocíclicos se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos con cetonas, en los que el anillo de triazina está formado por incorporación del átomo de carbono del grupo cetona-carbonilo y el átomo de oxígeno del grupo carbonilo de la cetona está reemplazado con el resto biguanida sustituido contenido en el compuesto de fórmula (I); véase, por ejemplo reacción análoga de biguanida y cetona de acuerdo con J. Med. Chem. 1985, 28, 1728-1740.

Son más preferidas preparaciones de compuestos heteroaromáticos, de forma particular s-triazinas, usando compuestos (I) en los que R^5 y R^6 son hidrógeno.

- 30 Los complejos de biguanidino-aluminio nuevos de fórmula (I) y sales de los mismos (= sales, dímeros y polímeros de los mismos) son particularmente adecuados para la preparación de 2,4-diamino-s-triazinas sustituidas en N mediante el procedimiento descrito a continuación.

Otro objeto de la presente invención es por tanto un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (V) o sales de los mismos,



- 35 en la que
 R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se definieron anteriormente,
 y
 Q es

- 40 a) hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_{12}$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_{12}$) o alquino ($\text{C}_2\text{-C}_{12}$), más preferiblemente alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) o alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), en el que cada uno de estos últimos seis radicales está no sustituido o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que
 45 consiste en halógeno, hidroxilo, $-\text{CN}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OCN}$, $-\text{SCN}$, amino, carbamoilo, alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfinilo, haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfinilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, haloalquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-amino, di[alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)]-amino, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-amino-carbonilo, di[alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)]-amino-carbonilo, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-amino-carbonilamino, di[alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)]-amino-carbonilamino, oxo, tiooxo, imino, N-alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-imino, N-[fenil-alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)]-imino, N-cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-

imino, N-[cicloalquil (C₃-C₆)-alquil (C₁-C₄)]-imino, [alcoxi (C₁-C₆)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₅-C₆), fenilo, naftilo, heterociclilo, heterociclilo benzocondensado, benzo-cicloalquilo (C₅-C₆), benzo-cicloalquenilo (C₅-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), benzo-cicloalcoxi (C₅-C₆), cicloalquenil (C₅-C₆)-oxi, benzo-cicloalquenil (C₅-C₆)-oxi, fenoxi, naftoxi, feniltio, heterocicililoxi, heterocicililoxi benzocondensado, heterocicililtio, y heterocicililtio benzocondensado

en el que cada uno de los 19 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -CN, NO₂, -OCN, -SCN, amino, carbamilo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, alquil (C₁-C₄)-amino, di-[alquil (C₁-C₄)]-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[alquil (C₁-C₄)]-amino-carbonilo y alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino, o, preferiblemente es hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), hidroxilo-alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆); más preferiblemente es alquilo (C₁-C₄) o haloalquilo (C₁-C₄), hidroxilo-alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄); más preferiblemente es haloalquilo (C₁-C₄),

b) o es cicloalquilo (C₃-C₆), benzo-cicloalquilo (C₅-C₆), cicloalquenilo (C₅-C₆), benzo-cicloalquenilo (C₅-C₆), fenilo, naftilo, heterociclilo, heterociclilo benzocondensado,

en los que cada uno de los 8 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -CN, -NO₂, -OCN, -SCN, amino, carbamilo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, alquil (C₁-C₄)-amino, di-[alquil (C₁-C₄)]-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[alquil (C₁-C₄)]-amino-carbonilo y alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di-[alquil (C₁-C₄)]-amino-carbonilamino, [alcoxi (C₁-C₆)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₅-C₆), fenilo, naftilo, heterociclilo, cicloalcoxi (C₃-C₆), cicloalquenil (C₅-C₆)-oxi, fenoxi, naftoxi, feniltio, heterocicililoxi y heterocicililtio,

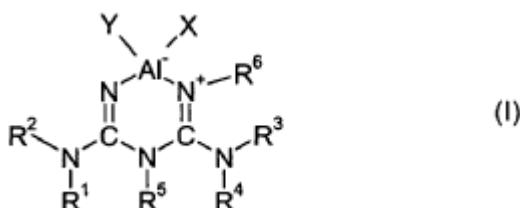
en los que cada uno de los 12 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -CN, -NO₂, -OCN, -SCN, amino, carbamilo, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, alquil (C₁-C₄)-amino, di-[alquil (C₁-C₄)]-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[alquil (C₁-C₄)]-amino-carbonilo y alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino

y, en el caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo de N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o, preferiblemente, es cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquilo (C₁-C₄),

c) o es COR, COOR, C(=S)R, C(=O)SR, C(=S)OR, C(=S)SR, en las que R en cada una de los 6 radicales recién citados es alquilo (C₁-C₁₈), cicloalquilo (C₃-C₆) o fenilo, estando los últimos tres radicales no sustituidos o sustituidos, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, CN, nitro, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio y en el caso de radicales básicos cíclicos también alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), o es CONR'R" o C(=S)NR'R", en las que cada uno de R' y R" en los dos radicales recién citados, independientemente uno de otro, es hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₈), cicloalquilo (C₃-C₆) o fenilo, estando los últimos tres radicales no sustituidos o sustituido, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, CN, nitro, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-tio, y en el caso de radicales básicos cíclicos también alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), o

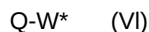
R' y R" junto con el átomo de nitrógeno forman un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros que pueden contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de N, O y S, y que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, CN, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄) y alquil (C₁-C₄)-tio,

caracterizado porque un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo



en la que

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se definieron en el compuesto de fórmula (V) que se va a preparar y R^5 y R^6 son hidrógeno, se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VI)



5 en la que

Q es como se definió en el compuesto de fórmula (V) que se va a preparar y

W^* es un átomo de carbono que porta 3 enlaces adicionales con 1, 2 ó 3 grupos salientes que están unidos por heteroátomos, preferiblemente heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en O, N, F, Cl, Br, I, S, P, Si y átomos de metal (es decir, el átomo de carbono está unido a 3 grupos salientes, cada uno mediante un enlace simple, unido a dos grupos salientes mediante un enlace simple y un enlace doble, respectivamente, y está unido a un grupo saliente mediante un enlace triple), y es preferiblemente el grupo funcional

-CO- X^1 (grupo haluro de ácido, $X^1 = F, Cl, Br$),

-CO-CN (grupo acilnitrilo),

-CO-O-COR* (anhídrido, $R^* = Q$ o R),

-CO-O- $X^2(O)_n(O_mR)_t$ (anhídrido mixto, $X = S, P, B$, $n = 0, 1, 2, 3$, $m = 0, 1, 2$, $t = 1, 2$),

-CO-O-R (grupo éster),

-CO-O-N=R (grupo aciloxima)

-CO-NR'R'' (grupo amida, $R'' = H, OR, NR, SR$ o R, o R' y R'' forman un anillo),

-CN (grupo nitrilo),

-C(=NR')NR'' (grupo amidina, $R', R'' = H$ o R, o R y R' forman un anillo),

-C(=NH)OR (iminoéter, ésteres imidácido),

-C(=NR')OR (iminioéter $R^1 = R$ (independientemente)),

-C(=O)SR o -C(=S)OR o -C(=S)SR (tioéster),

-C(=S)NR'R'' o -C(=NR')SR (tioamida o iminotioéter $R', R'' = H$ o R, o R y R' forman un anillo o R' y R'' forman un anillo)

-C(=NR) X^1 (grupo haloimidato, $X = F, Cl, Br$),

-C(=N⁺RR') X^{1-} (grupo haloimidio, $R' = R$ (independientemente), o R y R' forman un anillo, $X^1 = F, Cl, Br$),

-C(OR)(OR') X^1 (grupo haloacetal, $R' = R$ (independientemente o R y R' forman un anillo, $X^1 = F, Cl, Br$),

en la que en cada grupo subfórmula de W^* el grupo R es alquilo (C_1-C_{18}), cicloalquilo (C_3-C_6) o fenilo, estando los últimos tres radicales no sustituidos o sustituidos, preferiblemente no sustituidos o sustituidos con uno más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, CN, nitro, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio y en el caso de radicales básicos cíclicos también alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), y en caso de un anillo formado por R y R' o R' y R'' el anillo presenta preferiblemente de 3 a 6 átomos de anillo y está no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, dando el compuesto de fórmula (V) o una sal del mismo.

La formación de triazina se puede llevar a cabo también en masa o en presencia de un disolvente o mezcla de disolventes, preferiblemente disolvente no acuoso o mezcla de disolventes, por ejemplo, en un disolvente orgánico o mezcla de disolventes, que se han citado anteriormente como adecuados para la preparación de compuestos de fórmula (I) también.

Se prefieren como disolventes alcoholes o mezclas que incluyen un alcohol, preferiblemente un alcohol tal como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, iso-butanol, terc-butanol, pentanol, hexanol y ciclohexanol y mezclas de los mismos, más preferiblemente metanol, etanol, propanol o butanol y mezclas de los mismos.

La formación de triazina se lleva a cabo preferiblemente entre -20° C y 140° C, más preferiblemente entre 0° C y 120° C y especialmente entre 20° C y 100° C.

La formación de triazina se lleva a cabo preferiblemente con 1,0 a 10 equivalentes, más preferiblemente con 1,0 a 3,0 equivalentes de la especie Q-W, más preferiblemente con 1,0 a 2,0 equivalentes de la especie Q-W y especialmente con 1,0 a 1,6 equivalentes de la especie Q-W, basado en 1 equivalente del compuesto (I) o sal del mismo.

La formación de triazina se puede llevar a cabo también sin o preferiblemente en presencia de uno o más aditivos seleccionados del grupo que consiste en bases y compuestos que presenta grupos funcionales polares tales como grupos hidroxilo o amino, siendo estos dos últimos polares pero no particularmente básicos. El aditivo ayuda frecuentemente en la aceleración de la reacción, mejorando el rendimiento, haciendo que la reacción se lleve a cabo de forma más limpia y/o a una temperatura inferior en comparación con la reacción sin el aditivo.

Las siguientes bases se pueden usar como aditivos, por ejemplo, pero sin limitarse a estas:

a) sales tales como un alcóxido (alcóxido), carbonato, hidrogenocarbonato, fluoruro, fosfato, hidrogenofosfato, dihidrogenofosfato o hidróxido, donde el contra-ión puede ser un catión de metal derivado de metales, por ejemplo, metales alcalinos tales como litio, sodio, potasio, cesio (= caesium), o metales alcalinotérreos tales como magnesio, calcio, u otros metales tales como aluminio, o el contra-ión puede ser amonio, fosfonio, amonio o fosfonio sustituido por grupos orgánicos o puede ser otro catión orgánico,

b) una amina terciaria o aromática o mezclas de las mismas,

Se prefieren especialmente como base las mezclas de reacción que incluyen uno o más alcóxidos seleccionados del grupo que consiste en metóxido de metal, epóxido de metal, propóxido de metal, isopropóxido de metal, butóxido de metal, iso-butóxido de metal y terc-butóxido de metal.

El alcóxido, cuando está presente, se usa preferiblemente en una cantidad de 0,01 a 5 equivalentes y preferiblemente entre 0,01 y 2 equivalentes, basados en 1 equivalente de compuesto de fórmula (I) o sal del mismo.

La formación de triazina se puede llevar a cabo también en presencia de uno o más compuestos que presentan grupos (funcionales) polares que son de naturaleza menos básica que los alcóxidos citados anteriormente. Tales compuestos se seleccionan preferiblemente del grupo que consiste en polioles, aminoalcoholes y poliaminas.

Ejemplos de compuestos que presentan grupos polares son los siguientes compuestos que incluyen todos sus isómeros:

etanodiol, propanodiol, propanotriol, aminoetanol, aminoetanol N-mono- y N,N-disustituido, aminopropanol, aminopropanol N-mono- y N,N-disustituido, butanodiol, butanotriol, aminobutanol, aminobutanol N-mono- y N,N-disustituido, dietanolamina, dietanolamina N-sustituida, trietanolamina, dipropanolamina, dipropanolamina N-sustituida, etanodiamina, etanodiamina mono-, di-, tri- o terta-sustituida, propanodiamina y propanodiamina mono-, di-, tri- y tetra-sustituida, preferiblemente etanodiol, propanodiol y butanodiol, y mezclas de los mismos. Se prefieren especialmente 1,2-etanodiol, 1,2-propanodiol, 1,2-butanodiol y 1-metil-1,2-propanodiol, 1,4-butanodiol.

La sustancia con grupos polares, cuando está presente, se usa preferiblemente en una cantidad de 0,01 a 20 equivalentes, más preferiblemente de 0,01 a 10 equivalentes y especialmente de 0,01 a 5 equivalentes, en base a 1 equivalente del compuesto (I) o sal del mismo.

La formación de triazina se puede llevar a cabo también en presencia de ambos, una o más bases y una o más sustancias con grupos polares, de las cuales se prefieren mezclas que incluyen uno o más de etanodiol, propanodiol o butanodiol y uno o más metóxido, epóxido, propóxido, isopropóxido, butóxido, iso-butóxido y terc-butóxido (de metal).

La sustancia que presenta grupos polares, tales como el diol, aminoalcohol o diamina, y el alcóxido (de metal) actúan frecuentemente de forma sinérgica dando lugar reacciones que son más rápidas y/o más limpias y/o pueden progresar a una temperatura inferior que la que se puede alcanzar con cualquier reactivo por separado.

La formación de triazina se puede llevar a cabo también en presencia de una sal adicional que puede actuar como un agente deshidratante, por ejemplo, pero sin limitarse a estas:

sulfato de sodio (Na₂SO₄), sulfato de calcio (CaSO₄), haluros de calcio (CaCl₂, CaBr₂), sulfato de magnesio (MgSO₄), haluros de magnesio (MgCl₂, MgBr₂). La sal adicional se usa preferiblemente en cantidades estequiométricas o subestequiométricas basadas en la cantidad de compuesto de fórmula (I).

La formación de triazina se puede llevar a cabo también en presencia de una zeolita, arcilla u otra sustancia de absorción de agua que pueda actuar como un agente deshidratante.

La formación de triazina se puede llevar a cabo también en presencia de uno o varios de los aditivos citados anteriormente.

- 5 Se puede usar también la amina de fórmula (II) en la forma de una base libre o como una sal o sal mixta de un ácido tal como, por ejemplo: HF, HCl, HBr, HI, H₂SO₄, H₃PO₄, RSO₃H, RSO₂H, RPO₃H₂, o un complejo con AlX₃, BX₃, CO₂, SO₂, SO₃, PX₃, POX₃, PX₅, SiX₄ donde X es halógeno, un análogo de halógeno, alquiloxi, ariloxi, alquilamino, alquilarilamino o arilamino o derivados de los mismos, donde se prefieren los grupos alquilo que presenten de 1 a 6 átomos de carbono, y donde se prefiere que arilo sea fenilo.

La sal de la amina (II) se puede usar opcionalmente junto con la adición de una cantidad equivalente o más o menos que la cantidad equivalente de una base orgánica o inorgánica, preferiblemente una base no acuosa.

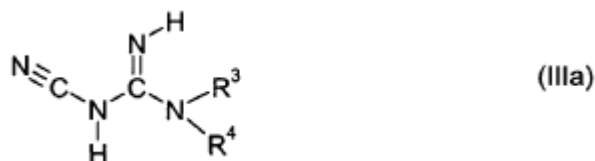
- 10 El procedimiento para la formación de la triazina se puede combinar directamente con el procedimiento para la preparación del complejo de Al de fórmula (I) sin aislamiento (o purificación) del compuesto de fórmula (I), de forma opcional en un procedimiento en una etapa.

Preferiblemente la invención proporciona un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (V) o sales de los mismos, caracterizado porque

- 15 (a) un compuesto de fórmula (II) o una sal del mismo,



en la que R¹ y R² se definen como en el compuesto de fórmula (V) que se va a preparar, se hace reaccionar dando un compuesto de fórmula (IIIa) o una sal del mismo,



- 20 en la que R³ y R⁴ se definen como en el compuesto de fórmula (I) que se va a preparar,

y una fuente de aluminio (III), de forma opcional, en presencia de un aditivo o disolvente prótico seleccionados del grupo que consiste en alcoholes o aminas, preferiblemente una fuente de aluminio (III) seleccionada de

- (i) sales de aluminio de fórmula (IV),



- 25 en la que

X e Y son como se definen en el compuesto de fórmula (I) que se va a preparar, y Z, independientemente de X, es un grupo saliente seleccionado del grupo de radicales como se definen para X o Y, o

- (ii) sales de aluminio de fórmula (IV'),

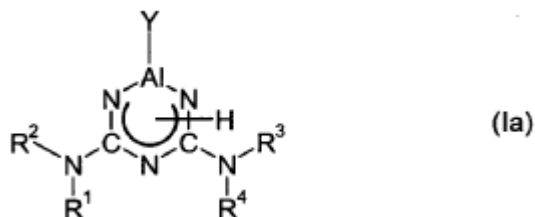


- 30 en la que

X', Y' y Z' se seleccionan cada uno del grupo que consiste en radicales como se definen para X, Y o Z, respectivamente y radicales que generan dicho grupo X, Y o Z, respectivamente en presencia de un aditivo o disolvente prótico X-H, Y-H o Z-H, respectivamente, con la condición de que 1, 2 ó 3 de los radicales X', Y' y Z' se seleccionen de dichos radicales que generan radicales X, Y y Z, respectivamente, en combinación con un aditivo o disolvente prótico X-H, Y-H o Z-H en las que cada uno de X, Y y Z se definen como se describe para X e Y en la fórmula (I), y sales de adición de los mismos,

- 35

dando un compuesto de fórmula (Ia) o una sal del mismo,



en la que R^1 , R^2 , R^3 y R^4 , se definen como en el compuesto de fórmula (V) que se va a preparar, y en la que Y es como se define en la fórmula (I) anterior, y

- 5 (b) el compuesto de fórmula (I) obtenido en la etapa (a), opcionalmente sin aislamiento y purificación, se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VI)



en la que Q se define como para Q en la fórmula (V) que se va a preparar, y W* se define en la fórmula (VI) definida anteriormente, dando un compuesto de fórmula (V) o una sal del mismo.

- 10 El procedimiento para la preparación de compuestos (V) mediante compuestos (I) tiene lugar con mayor rendimiento y pureza en condiciones de reacción moderadas.

En los siguientes ejemplos no limitantes las cantidades y porcentajes se relacionan con el peso a menos que se defina específicamente de otra forma.

A) Ejemplos de preparación

- 15 Abreviaturas usadas en los ejemplos:

h (s) = hora (s)

ml = mililitros

pf = punto de fusión

A1) 4-Morfolino-6-[(1S)-1-cloroetil]-1,3,5-triazin-2-amina

- 20 A1a) Se agitaron una mezcla de 108 g de morfolina, 163 g de cianoguanidina, 347 g de isopropóxido de aluminio y 267 g de 1-metoxi-2-propanol en nitrógeno y se calentaron hasta 90° C durante 22,5 horas (véase el ejemplo la-1.181 de la tabla II).

- 25 A1 b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A1a hasta 70° C, y se añadió 530 g de metanol cuidadosamente. Tras adición completa se añadió 178 g de (2S)-2-cloro-propionato de metilo. Después de 22 horas a 70° C se añadió la mezcla de reacción a 2400 ml de ácido acético al 10% a 70° C. Se eliminaron los disolventes de bajo punto de ebullición en un ligero vacío (840 ml). Se enfrió luego la suspensión hasta 30° C, se filtró y se lavó con 2 x 240 g de ácido acético al 10% y luego 2 x 480 g de agua. Se secó luego el sólido a vacío. Producto: 199 g, rendimiento 68%, pf: 177-8° C (véase el ejemplo V-1 de la tabla I).

A2) N-Bencil-6-[(1S)-1-hidroxietil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina

- 30 A2a) Se suspendieron 130 g de bencilamina, 163 g de cianoguanidina y 347 g de isopropóxido de aluminio en 267 g de 1-metoxi-2-propanol y se calentaron hasta 90° C durante 10 horas (véase el ejemplo la-1.182 de la tabla II).

- 35 A2b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A2a hasta 75° C, y se añadieron 530 g de metanol y 153 g de S-lactato de metilo. Después de 22 horas se añadió la mezcla de reacción a 2400 g de ácido acético al 10% que se ha precalentado hasta 70° C. Se eliminó mediante destilación 740 ml de disolvente hasta una temperatura interna de 88° C, se enfrió la mezcla hasta 20° C y se extrajo 3 veces con 2000 ml de acetato de etilo. Se secaron las capas orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró a vacío. El producto resultante fue un aceite. Rendimiento del producto: 260 g, 83 % (véase el ejemplo V-2 de la tabla I).

A3) N-Ciclohexil-6-metoximetil-1,3,5-triazin-2,4-diamina

- 40 A3a) Se suspendieron 50 g de ciclohexilamina, 68 g de cianoguanidina y 144 g de isopropóxido de aluminio en 110 g de 1-metoxi-2-propanol y se calentó hasta 90° C durante 4 horas (véase el ejemplo la-1.183 de la tabla II).

A3b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A3a se enfrió luego hasta 75° C, y se añadieron 220 g de metanol y 63,7 g de metoxiacetato de metilo. Después de 16 horas se añadió la mezcla de reacción a 1000 g de ácido

acético al 10% que se ha precalentado hasta 70° C. Se eliminó 330 ml de disolvente mediante destilación hasta una temperatura interna de 88° C, se enfrió la mezcla hasta 20° C y se extrajo 3 veces con 1000 ml de tolueno. Se secaron las capas orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró a vacío. El producto resultante fue un aceite que solidificó en reposo. Rendimiento del producto: 101 g (85 %), pf: 103-6° C (véase el ejemplo V-3 de la tabla I).

A4) N-[(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il]-6-[(1R)-1-fluoroetil]-1,3,5- triazin-2,4-diamina

A4a) Se agitaron una mezcla de 53,1 g de 1R-1-amino-6-metilindano, 56,5 g de cianoguanidina, 127 g de isopropóxido de aluminio y 75 g de isopropanol en nitrógeno y se calentó hasta reflujo durante 22,5 horas (véase el ejemplo la-1.5 de la tabla II).

A4b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A4a hasta 75° C, y se añadieron cuidadosamente 70 g de 1,2-propanodiol y 182 g de metanol. Después de la adición completa se añadió 45,5 g de (2R)-2-fluoro-propionato de metilo. Después de 23 horas a 70° C de temperatura interna se añadió la mezcla de reacción a 870 g de ácido acético al 10 % a 70° C. Se enfrió luego la suspensión hasta 20° C, se filtró y se lavó dos veces con 160 g de ácido acético al 5% y luego dos veces con 160 g de agua. Se secó luego el sólido a vacío. Rendimiento del producto: 81,7 g (81 %), pf: 135-136° C (véase el ejemplo V-4 de la tabla I).

A5) 4-[1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-2-il]-6-[(1R)-1-fluoroetil]-1,3,5-triazin-2-amina

A5a) Se agitaron una mezcla de 48 g de 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina, 56,5 g cianoguanidina, 128 g de isopropóxido de aluminio y 75 g de isopropanol en nitrógeno y se calentó hasta reflujo durante 22 horas (véase el ejemplo la-1.8 de la tabla II).

A5b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A5a hasta 75° C, y se añadieron cuidadosamente 70 g de 1,2-propanodiol y 182 g de metanol. Después de adición completa se añadió 45,5 g de (2R)-2-fluoro-propionato de metilo. Después de 23 horas a 70° C de temperatura interna se añadió luego la mezcla de reacción a 862 g de ácido acético al 10% a 70° C. Se enfrió luego la suspensión hasta 20° C, se filtró y se lavó dos veces con 160 g de ácido acético al 5% y luego dos veces con 160 g de agua. Se secó luego el sólido a vacío. Rendimiento del producto: 68,5 g (71 %), pf: 186-9° C (véase el ejemplo V-5 de la tabla I).

A6) N-[1,2,3,4-Tetrahidronaft-1-il]-6-[(1S)-1-cloroetil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina

A6a) Se suspendieron 136,6 g de 1,2,3,4-tetrahidronaftalina, 122 g de cianoguanidina y 260 g de isopropóxido de aluminio en 203 g de 1-metoxi-2-propanol y se calentó hasta 90° C durante 24 horas (véase el ejemplo la-1.189 de la tabla II).

A6b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A6a hasta 75° C, y se añadieron 400 g de metanol y 134 g de (2S)-2-cloropropionato de metilo. Después de 23 horas se añadió la mezcla de reacción a 1800 g de ácido acético al 10% que se había precalentado hasta 70° C. Se eliminó 550 ml de disolvente por destilación hasta una temperatura interna de 86° C, se enfrió la mezcla hasta 20° C y se filtró y se lavó dos veces con 180 g de ácido acético al 5% y luego dos veces con 180 g de agua. Se secó luego el sólido a vacío. Rendimiento del producto: 209 g (76%), pf: 169-70° C (véase el ejemplo V-6 de la tabla I).

A7) 4-[1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-2-il]-6-isopropil-1,3,5-triazin-2-amina

A7a) Se suspendieron una mezcla de 68,7 g de 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina, 67,9 g de cianoguanidina y 144 g de isopropóxido de aluminio en 111 g de 2-etoxietanol y se calentó hasta 90° C durante 21 horas (véase el ejemplo la-1.224 de la tabla II).

A7b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A7a hasta 75° C, y se añadieron 222 g de metanol, 65 g de isobutirato de metilo y 90 g de metóxido de sodio al 30%. Después de 23 horas se añadió la mezcla de reacción a 1000 g ácido acético al 10% que se ha precalentado hasta 70° C. Se eliminó 430 ml de disolvente por destilación hasta una temperatura interna de 86° C, se enfrió la mezcla hasta 20° C y se filtró y se lavó dos veces con 240 g de ácido acético al 5% y luego dos veces con 240 g de agua. Se secó luego el sólido a vacío. Rendimiento del producto: 107 g (79 %), pf: >255° C (véase el ejemplo V-7 de la tabla I).

A8) N-[(1R,2S)-2,6-Dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-6-difluorometil-1,3,5- triazin-2,4-diamina

A8a) Se suspendieron una mezcla de 87 g de 1R,2S-1-amino-2,6-dimetilindano, 67,9 g de cianoguanidina y 146 g de isopropóxido de aluminio en 111 g de 1-metoxi-2-propanol y se calentó hasta 90° C durante 24 horas (véase el ejemplo la-1.192 de la tabla II).

A8b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A8a hasta 70° C y se añadieron 222 g de metanol, 104 g de 1,2-propanodiol y 68,9 g de difluoropropionato de metilo. Después de 23 horas se añadió la mezcla de reacción a 1000 g ácido acético al 10% y 1000 ml de tolueno que se había precalentado hasta 70° C. Se eliminó 370 ml de disolvente por destilación hasta una temperatura interna de 87° C, se enfrió la mezcla hasta 20° C, se separaron las fases y se extrajo la fase orgánica dos veces con 500 ml de tolueno. Se secaron las fases reunidas sobre sulfato de sodio y se

evaporaron. Se secó luego el sólido a vacío. Rendimiento del producto: 134 g (81 %), pf: 87-88° C (véase el ejemplo V-8 de la tabla I).

A9) N-[(1R,2S)-2,4,6-Trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-6-[(1S)-1-cloroetil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina

5 A9a) Se suspendieron una mezcla de 7,6 g de 1R,2S-1-amino-2,4,6-trimetilindano, 5,6 g de cianoguanidina y 12,0 g de isopropóxido de aluminio en 8,8 g de 1-metoxi-2-propanol y se calentó hasta 90° C durante 16 horas (véase el ejemplo la-1.198 de la tabla II).

10 A9b) Se enfrió la mezcla de reacción obtenida en A9a hasta 70° C, y se añadieron 18,2 g de metanol y 6,1 g de (2S)-2-cloropropionato de metilo. Después de 22 horas se añadió la mezcla de reacción a 85 g de ácido acético al 10% que se había precalentado hasta 70° C. Se eliminó por destilación 20 ml de disolvente hasta una temperatura interna de 87° C. Se enfrió luego la mezcla hasta 20° C y se filtró y se lavó dos veces con 10 g de ácido acético al 10% y luego dos veces con 20 g de agua. Se secó luego el sólido a vacío. Rendimiento del producto: 6,3 g (45 %), pf: 85-87° C (véase el ejemplo V-9 de la tabla I).

A10) Metoxi-isopropóxido de N-[(1S,2R)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-biguanidino-aluminio

15 Se agitaron una mezcla de 2,62 g de (1S,2R)-1-amino-2,6-dimetilindano, 1,40 g de cianoguanidina, 3,40 g de isopropóxido de aluminio y 2,54 g de 1-metoxi-2-propanol en nitrógeno y se calentó a 103° C. Después de 22 horas se enfrió la reacción hasta 50° C y se concentró a vacío. Se suspendió el residuo en 20 ml de tolueno y se reevaporó. Se secó luego el sólido amorfo a vacío. Se llevó a cabo la confirmación estructural con RMN Al²⁷, RMN H¹ y RMN C¹³ en D₈-isopropanol (véase el ejemplo la-1.199 en la tabla II).

A11) Metoxi-isopropóxido de N-[(1R)-ciclobutil-2-fenilet-1-il]-biguanidinoaluminio

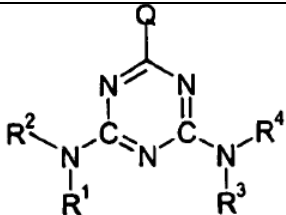
20 Se agitaron una mezcla de 3,08 g de (1R)-ciclobutil-2-fenilet-1-il-amina, 1,42 g de cianoguanidina, 3,40 g de isopropóxido de aluminio y 2,54 g de 1-metoxi-2-propanol en nitrógeno y se calentó hasta 103° C. Después de 22 horas se enfrió la reacción hasta 50° C y se concentró a vacío. Se suspendió el residuo en 20 ml de tolueno y se reevaporó. Se secó luego el sólido amorfo a vacío. Se llevó a cabo la confirmación estructural con RMN Al²⁷, RMN H¹ y RMN C¹³ en D₈-isopropanol (véase el ejemplo la-1.215 en la tabla II).

25 A12) Metoxi-isopropóxido de N-pent-3-ilbiguanidinoaluminio

30 Se agitaron una mezcla de 1,37 g de 3-pentilamina, 1,40 g de cianoguanidina, 3,40 g de isopropóxido de aluminio y se agitaron 3 g de isopropanol en nitrógeno y se calentó hasta 85° C. Después de 22 horas se enfrió la reacción hasta 50° C y se concentró a vacío. Se suspendió el residuo en 20 ml de tolueno y se reevaporó. Se secó luego el sólido amorfo a vacío. Se llevó a cabo la confirmación estructural con RMN Al²⁷, RMN H¹ y RMN C¹³ en D₈-isopropanol (véase el ejemplo la-1.33 en la tabla II).

Los compuestos de fórmula (V) de la siguiente tabla I se prepararon de forma análoga a los ejemplos de preparación A1 (a, b) a A9 (a, b) y A10 a A12 a partir de los respectivos compuestos de fórmula (I) como se muestra en la tabla II.

Tabla I: compuestos de fórmula (Va)

 (Va)					
Compuesto	Q	NR ¹ R ²	NR ³ R ⁴	Aditivo	Disolvente
V-1	(1S)-1-Cloroetilo	Morfolinilo	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-2	(1S)-1-Hidroxietilo	Bencilamino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-3	Metoximetilo	Ciclohexilamino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-4	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NH ₂	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-5	(1R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolino-2-ilo	NH ₂	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-6	(1S)-1-Cloroetilo	(1RS)- 1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-7	Isopropilo	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolino-2-ilo	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH

V-8	Difluorometilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-9	(1S)-1-Cloroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-10	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-11	(1S)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	NaOC ₂ H ₅	CH ₃ OH
V-12	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	1,2-propanodiol	CH ₃ OH
V-13	Difluorometilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-14	(1R)-1-Fluoroetilo	(1RS)- 1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OH
V-15	(1R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-iso-quinolino-2-ilo	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol)	CH ₃ OH
V-16	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OH
V-17	Difluorometilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ ,	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-18	Difluorometilo	1,2,3,4-Tetrahidro-iso-quinolino-2-ilo	NH ₂	NaOCH ₃ ,	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-19	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-20	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R,S)-1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-21	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-22	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-23	(1S)-1-Fluoroetilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-24	1-Fluoro-1-metiletilo	(2R,S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-25	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-26	1-Fluoro-1-metiletilo	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-27	1-Fluoro-1-metiletilo	1,1-diciclopropiletil-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-28	1-Fluoro-1-metiletilo	Pent-3-ilamino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-29	1-Fluoro-1-metiletilo	(4RS)-3,4-Dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-30	1-Fluoro-1-metiletilo	(4R)-3,4-Dihidro-2H-cromen-4-il-	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH

		amino			
V-31	1-Fluoro-1-metiletilo	(4S)-3,4-Dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-32	1-Fluoro-1-metiletilo	(3RS, 4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-33	1-Fluoro-1-metiletilo	(3R, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-34	1-Fluoro-1-metiletilo	(3S, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-35	1-Fluoro-1-metiletilo	(1 RS)-1-ciclopropiletil-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-36	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-1-ciclopropiletil-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-37	1-Fluoro-1-metiletilo	(1S)-1-ciclopropiletil-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-38	1-Fluoro-propilo	(1 RS)-1-(4-clorfenilo)et-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-39	1-Fluoro-propilo	(1 R)-1-(4-clorfenilo)et-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-40	1-Fluoro-propilo	(1S)-1-(4-clorfenilo)et-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-41	(1S)-1-Cloroetilo	(1R)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-42	(1S)-1-Cloroetilo	(1S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-43	(1R)-1-Fluoroetilo	(1 R)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OH
V-44	(1R)-1-Fluoroetilo	(1S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-propanodiol	CH ₃ OH
V-45	(1S)-1-Cloroetilo	Morfolino-ilo	NHBz	-	CH ₃ OH
V-46	(1S)-1-Hidroxietilo	Bencilamino	NHBz	-	CH ₃ OH
V-47	Metoximetilo	Ciclohexilamino	NHBz	-	CH ₃ OH
V-48	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-49	(1 R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolino-2-ilo	NHBz	1,2-Propanodiol CH ₃ OH	CH ₃ OH
V-50	(1S)-1-Cloroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	-	CH ₃ OH
V-51	(1S)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolino-2-ilo	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-52	Difluorometilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-53	(1S)-1-Cloroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	-	CH ₃ OH
V-54	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-55	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-	NHBz	NaOC ₂ H ₅	CH ₃ OH

		Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1-il-amino			
V-56	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1-il-amino	NHBz	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-57	Difluorometilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-58	(1R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-59	(1R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolino-2-ilo	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-60	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1 il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-61	Difluorometilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1 il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-62	Difluorometilo	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolino-2-ilo	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-63	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-64	1-Fluoro-1-metiletilo	(1RS)-1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-65	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-66	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-67	(1S)-1-Fluoroetilo	(1R)-1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₅ OCH(CH ₃) ₂
V-68	1-Fluoro-1-metiletilo	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-69	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ OH
V-70	1-Fluoro-1-metiletilo	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi)et-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-71	1-Fluoro-1-metiletilo	1,1-diciclopropilet-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-72	1-Fluoro-1-metiletilo	Pent-3-ilamino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-73	1-Fluoro-1-metiletilo	3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-74	1-Fluoro-1-metiletilo	(4R)-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-75	1-Fluoro-1-metiletilo	(4S)-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-76	1-Fluoro-1-metiletilo	(3RS, 4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-77	1-Fluoro-1-metiletilo	(3R, 4R)-3-Metil-il-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-78	1-Fluoro-1-metiletilo	(3S, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH

V-79	1-Fluoro-1-metiletilo	(1RS)-1-ciclopropiletil-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-80	7-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-1-ciclopropiletil-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-81	1-Fluoro-1-metiletilo	(1S)-1-ciclopropiletil-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-82	1-Fluoro-propilo	(1RS)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-83	1-Fluoro-propilo	(1R)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-84	1-Fluoro-propilo	(1S)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-85	(1S)-1-Cloroetilo	(1R)-1,2,3,4-Tetraidro-naft-1-il-amino	NHBz	-	CH ₃ OH
V-86	(1S)-1-Cloroetilo	(1S)-1,2,3,4-Tetraidro-naft-1-il-amino	NHBz	-	CH ₃ OH
V-87	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-1,2,3,4-Tetraidro-naft-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-88	(1R)-1-Fluoroetilo	(1S)-1,2,3,4-Tetraidro-naft-1-il-amino	NHBz	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-89	(1S)-1-Cloroetilo	Morfolin-ilo	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-90	(1S)-1-Hidroxietilo	Bencilamino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-91	Metoximetilo	Ciclohexilamino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-92	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-93	(1R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetraidro-iso-quinolin-2-il	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-94	(1S)-1-Cloroetilo	(1RS)-1,2,3,4-Tetraidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-95	(1S)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetraidro-isoquinolin-2-il	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-96	Difluorometilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-97	(1S)-1-Cloroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-98	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-99	(1S)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-100	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-101	Difluorometilo	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-102	(1R)-1-Fluoroetilo	(1RS)-1,2,3,4-Tetraidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-103	(1R)-1-Fluoroetilo	1,2,3,4-Tetraidro-isoquinolin-2-il	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH

V-104	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-105	Difluorometilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-106	Difluorometilo	1,2,3,4-Tetraidro-isoquinolin-2-il	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-107	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-108	1-Fluoro-1-metiletilo	1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-109	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-110	(1R)-1-Fluoroetilo	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-111	(1S)-1-Fluoroetilo	(1 R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-112	1-Fluoro-1-metiletilo	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-113	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-114	1-Fluoro-1-metiletilo	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-115	1-Fluoro-1-metiletilo	1,1-diciclopropilmetil-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-116	1-Fluoro-1-metiletilo	Pent-3-ilamino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-117	1-Fluoro-1-metiletilo	(4RS)-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-118	1-Fluoro-1-metiletilo	(4R)-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-119	1-Fluoro-1-metiletilo	(4S)-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-120	1-Fluoro-1-metiletilo	(3RS, 4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-121	1-Fluoro-1-metiletilo	(3R, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-122	1-Fluoro-1-metiletilo	(4S, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-123	1-Fluoro-1-metiletilo	(1RS)-1-ciclopropilet-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-124	1-Fluoro-1-metiletilo	(1R)-1-ciclopropilet-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-125	1-Fluoro-1-metiletilo	(1S)-1-ciclopropilet-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-126	1-Fluoro-propilo	(1RS)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-127	1-Fluoro-propilo	(1R)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-128	1-Fluoro-propilo	(1S)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH

V-129	(1S)-1-Cloroetilo	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	-	CH ₃ OH
V-130	(1S)-1-Cloroetilo	(1 S)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	-	CH ₃ OH
V-131	(1R)-1-Fluoroetilo	(1 R)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-132	(1R)-1-Fluoroetilo	(1 S)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-133	(1S)-1-Cloroetilo	(3S, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-134	(1S)-1-Cloroetilo	(4R, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	-	CH ₃ OH
V-135	(1R)-1-Fluoroetilo	(3S, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-136	(1R)-1-Fluoroetilo	(4R, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	1,2-Propanodiol	CH ₃ OH
V-137	1-Fluoro-1-metiletilo	(3S, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-138	1-Fluoro-1-metiletilo	(4R, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃ , 1,2-Propanodiol	CH ₃ OCH(CH ₃) ₂
V-139	Difluorometilo	(3S, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH
V-140	Difluorometilo	(4R, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	NaOCH ₃	CH ₃ OH

Abreviaturas en la tabla I:

Bz = bencilo

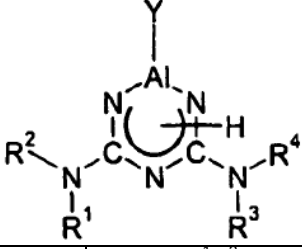
NHBz = bencilamino

5 NBz₂ = dibencilamino

Condiciones de reacción como en los ejemplos de la tabla I:

- 1) Temperatura de reacción de 70 a 75° C en todos los experimentos usados
- 2) Rendimiento en general en el intervalo de porcentaje de 70 a 85 del valor teórico, a veces menos rendimiento cuando se ha omitido aditivo

Tabla II: compuestos de fórmula (Ia-1)

 (Ia-1)					
Compuesto nº	Y	NR ¹ R ²	NR ³ R ⁴	Fuente de Al	Disolvente
(Ia-1.1)	O-i-Pr	Morfolin-ilo	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.2)	O-i-Pr	Bencilamino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.3)	O-i-Pr	Ciclohexilamino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.4)	O-i-Pr	(1RS)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.5)	O-i-Pr	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.6)	O-i-Pr	(1S)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.7)	O-i-Pr	1,2,3,4-Tetrahydroquinolin-1-il	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.8)	O-i-Pr	1,2,3,4-Tetrahydroisoquinolin-2-il	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.9)	O-i-Pr	(1RS)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.10)	O-i-Pr	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.11)	O-i-Pr	(1S)-1,2,3,4-tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.12)	O-i-Pr	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.13)	O-i-Pr	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.14)	O-i-Pr	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.15)	O-i-Pr	(1S,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.16)	O-i-Pr	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.17)	O-i-Pr	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.18)	O-i-Pr	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.19)	O-i-Pr	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.20)	O-i-Pr	(3RS,4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH

		cromen-4-il-amino			
(Ia-1.21)	O-i-Pr	(3R,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.22)	O-i-Pr	(3S,4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.23)	O-i-Pr	(1RS)-1-ciclopropilet-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.24)	O-i-Pr	(1R)-ciclopropilet-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.25)	O-i-Pr	(1 S)-ciclopropilet-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.26)	O-i-Pr	(1RS)-1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.27)	O-i-Pr	(1R)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.28)	O-i-Pr	(1S)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.29)	O-i-Pr	(1 RS)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.30)	O-i-Pr	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.31)	O-i-Pr	(1 S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.32)	O-i-Pr	1,1-Diciclopropilmetil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.33)	O-i-Pr	Pent-3-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.34)	O-i-Pr	(1RS)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.35)	O-i-Pr	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.36)	O-i-Pr	(1S)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.37)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Morfolin-ilo	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.38)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Bencil-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.39)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Ciclohexil-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.40)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.41)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.42)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1S)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1 il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.43)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	1,2,3,4-Tetrahidro-quinolin-1-il	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.44)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolin-2-il	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.45)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.46)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1 R)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃

		amino			
(Ia-1.47)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1 S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.48)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.49)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.50)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.51)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.52)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.53)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.54)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.55)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,6-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.56)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(3RS,4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.57)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(3R,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.58)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(3S,4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.59)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1 -ciclopropiletil-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.60)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1 R)-ciclopropiletil-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.61)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1 S)-ciclopropiletil-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.62)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.63)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.64)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.65)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.66)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.67)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.68)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1,1-Diciclopropilmetil-	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃

		amino			
(Ia-1.69)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	Pent-3-ilamino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.70)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.71)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.72)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.73)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Morfolin-ilo	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.74)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Bencilamino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.75)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Ciclohexilamino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.76)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.77)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.78)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.79)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro-quinolin-1-il	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.80)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolin-2-il	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.81)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.82)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.83)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1 S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.84)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.85)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.86)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.87)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.88)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1 R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.89)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.90)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.91)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,6-metil-1H-inden-1il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.92)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(3RS,4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅

(Ia-1.93)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(3R,4R)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.94)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(3S,4S)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.95)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-Ciclopropiletil- amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.96)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-Ciclopropiletil- amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.97)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1 S)- Ciclopropiletil- amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.98)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-(4-clorofenil)et-1- il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.99)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-(4- clorofenil)et-1-il- amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.100)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-(4- clorofenil)et-1-il- amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.101)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-Metil-2-(3,5- dimetilfeniloxi) et- 1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.102)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-1-Metil-2-(3,5- dimetilfeniloxi) et- 1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.103)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-1-Metil-2-(3,5- dimetilfeniloxi) et- 1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.104)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,1- Diciclopropilmetil- amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.105)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Pent-3-ilamino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.106)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-Ciclobutil-2- fenilet-1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.107)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1 R)-Ciclobutil-2- fenilet-1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.108)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1 S)-Ciclobutil-2- fenilet-1-il-amino	NBz ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.109)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Morfolin-ilo	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.110)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Bencilamino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.111)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Ciclohexilamino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.112)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	2,3-Dihidro-6-metil- 1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.113)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-2,3-Dihidro-6- metil-1H-inden-1il- amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.114)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-2,3-Dihidro-6- metil-1H-inden-1il- amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.115)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro- quinolin-1-il	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.116)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro- isoquinolin-2-il	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.117)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro- naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.118)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-1,2,3,4- Tetrahidro-naft-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅

(Ia-1.119)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.120)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.121)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.122)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.123)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.124)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.125)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.126)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.127)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,6-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.128)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3R,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.129)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3R,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.130)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3S, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.131)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-Ciclopropiletil-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.132)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-Ciclopropiletil-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.133)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-Ciclopropiletil-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.134)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.135)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.136)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.137)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.138)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.139)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.140)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,1-Diciclopropilmetil-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.141)	-OCH(CH ₃)	Pent-3-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH

	C ₂ H ₅				(CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.142)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.143)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.144)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH (CH ₃)C ₂ H ₅
(Ia-1.145)	O-i-Pr	Morfolin-ilo	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.146)	O-i-Pr	Bencilamino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.147)	O-i-Pr	Ciclohexilamino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.148)	O-i-Pr	2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.149)	O-i-Pr	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.150)	O-i-Pr	(1S)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.151)	O-i-Pr	1,2,3,4-Tetrahidro-quinolin-1-il	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.152)	O-i-Pr	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolin-2-il	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.153)	O-i-Pr	1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.154)	O-i-Pr	(1R)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.155)	O-i-Pr	(1S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.156)	O-i-Pr	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.157)	O-i-Pr	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.158)	O-i-Pr	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.159)	O-i-Pr	(1S,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.160)	O-i-Pr	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.161)	O-i-Pr	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.162)	O-i-Pr	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.163)	O-i-Pr	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,6-metil-1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.164)	O-i-Pr	(3RS,4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.165)	O-i-Pr	(3R,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.166)	O-i-Pr	(3S, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH

		cromen-4-il-amino			
(Ia-1.167)	O-i-Pr	1-Ciclopropilet-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.168)	O-i-Pr	(1R)-Ciclopropilet-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.169)	O-i-Pr	(1S)-Ciclopropilet-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.170)	O-i-Pr	1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.171)	O-i-Pr	(1R)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.172)	O-i-Pr	(1S)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.173)	O-i-Pr	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.174)	O-i-Pr	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.175)	O-i-Pr	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.176)	O-i-Pr	1,1-Diciclopropilmetil-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.177)	O-i-Pr	Pent-3-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.178)	O-i-Pr	1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.179)	O-i-Pr	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.180)	O-i-Pr	(1S)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.181)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Morfolin-ilo	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.182)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Bencil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.183)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Ciclohexil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.184)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.185)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1R)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.186)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1S)-2,3-Dihidro-6-metil-1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.187)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	1,2,3,4-Tetrahidro-quinolino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.188)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	1,2,3,4-Tetrahidro-isoquinolin-2-il	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.189)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1RS)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.190)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1R)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.191)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1S)-1,2,3,4-Tetrahidro-naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.192)	-OCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃

(Ia-1.193)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.194)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.195)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S,2S)-2,3-Dihidro-2,6-dimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.196)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.197)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.198)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R,2S)-2,3-Dihidro-2,4,6-trimetil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.199)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S,2R)-2,3-Dihidro-2-metil-1H-inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.200)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(3RS,4RS)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.201)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(3R,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.202)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(3S, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.203)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-Ciclopropiletil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.204)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-Ciclopropiletil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.205)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-Ciclopropiletil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.206)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.207)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.208)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.209)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.210)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.211)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.212)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1,1-Diciclopropilmetil-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.213)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	Pent-3-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.214)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.215)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.216)	-OCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃	(1S)-Ciclobutil-2-	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH(CH ₃) CH ₂ OCH ₃

	CH ₂ OCH ₃	fenilet-1-il-amino			CH ₂ OCH ₃
(Ia-1.217)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Morfolin-ilo	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.218)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Bencilamino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.219)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Ciclohexilamino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.220)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,S)-2,3-Dihidro- 6-metil-1H-inden- 1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.221)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-2,3-Dihidro-6- metil-1H-inden-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.222)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-2,3-Dihidro-6- metil-1H-inden-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.223)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro- quinolin-1-il	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.224)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro- isoquinolin-2-il	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.225)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahidro- naft-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.226)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-1,2,3,4- Tetrahidro-naft-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.227)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-1,2,3,4- Tetrahidro-naft-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.228)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3- Dihidro-2,6-dimetil- 1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.229)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3- Dihidro-2,4,6- trimetil-1H-inden- 1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.230)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3- Dihidro-2,6-dimetil- 1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.231)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2S)-2,3- Dihidro-2,6-dimetil- 1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.232)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3- Dihidro-2-metil-1- H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.233)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3- Dihidro-2-metil-1- H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.234)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3- Dihidro-2,4,6- trimetil-1H-inden- 1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.235)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3- Dihidro-2,6-metil- 1H-inden-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.236)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(3R,S,4R,S)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.237)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(3R,4R)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.238)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(3S, 4S)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.239)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-Ciclopropiletil- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅

(Ia-1.240)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-Ciclopropilet-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.241)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-Ciclopropilet-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.242)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-(4-clorofenil)et-1- il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.243)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-(4- clorofenil)et-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.244)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-(4- clorofenil)et-1-il- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.245)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-Metil-2-(3,5- dimetilfeniloxi) et- 2-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.246)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-1-Metil-2-(3,5- dimetilfeniloxi) et- 2-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.247)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-1-Metil-2-(3,5- dimetilfeniloxi) et- 2-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.248)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1,1- Diciclopropilmetil- amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.249)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	Pent-3-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.250)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	1-Ciclobutil-2- fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.251)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R)-Ciclobutil-2- fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.252)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S)-Ciclobutil-2- fenilet-1-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.253)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3- Dihidro-2,4,6- trimetil-1H-inden- 1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.254)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2S)-2,3- Dihidro-2,4,6- trimetil-1H-inden- 1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.255)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3- Dihidro-2-metil-1H- inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.256)	-OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	(1S,2S)-2,3- Dihidro-2-metil-1H- inden-1il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.257)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Morfolin-ilo	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.258)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Bencil-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.259)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Ciclohexil-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.260)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	2,3-Dihidro-6-metil- 1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.261)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-2,3-Dihidro-6- metil-1H-inden-1il- amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.262)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-2,3-Dihidro-6- metil-1H-inden-1il-	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃)

		amino			C ₂ H ₅
(Ia-1.263)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahydro- quinolin-1-ilo	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.264)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahydro- isoquinolin-2-ilo	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.265)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,2,3,4-Tetrahydro- naft-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.266)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-1,2,3,4- Tetrahydro-naft-1-il- amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.267)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-1,2,3,4- Tetrahydro-naft-1-il- amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.268)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3- Dihidro-2,6-dimetil- 1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.269)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3- Dihidro-2,4,6- trimetil-1H-inden- 1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.270)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3- Dihidro-2,6-dimetil- 1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.271)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S,2S)-2,3- Dihidro-2,6-dimetil- 1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.272)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3- Dihidro-2-metil-1 H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.273)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2R)-2,3- Dihidro-2-metil-1 H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.274)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R,2S)-2,3- Dihidro-2,4,6- trimetil-1H-inden- 1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.275)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S,2R)-2,3- Dihidro-2,6-metil- 1H-inden-1il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.276)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3R,4R)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.277)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3R,4R)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.278)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3S, 4S)-3-Metil- 3,4-dihidro-2H- cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.279)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-Ciclopropiletil- amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.280)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-Ciclopropiletil- amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.281)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-Ciclopropiletil- amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅

					C ₂ H ₅
(Ia-1.282)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.283)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.284)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-(4-clorofenil)et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.285)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-2-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.286)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.287)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-1-Metil-2-(3,5-dimetilfeniloxi) et-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.288)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1,1-Diciclopropilmetil-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.289)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	Pent-3-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.290)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	1-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.291)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1R)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.292)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(1S)-Ciclobutil-2-fenilet-1-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.293)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3S,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.294)	-OCH(CH ₃) C ₂ H ₅	(3R,4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NHBz	Al(O-i-Bu) ₃	HOCH(CH ₃) C ₂ H ₅
(Ia-1.295)	-OCH ₂ CH ₂ O C ₂ H ₅	(3S, 4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.296)	-OCH ₂ CH ₂ O C ₂ H ₅	(3R,4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	HOCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅
(Ia-1.297)	O-i-Pr	(3S,4R)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH
(Ia-1.298)	O-i-Pr	(3R, 4S)-3-Metil-3,4-dihidro-2H-cromen-4-il-amino	NH ₂	Al(O-i-Pr) ₃	(CH ₃) ₂ CHOH

Condiciones de reacción para tabla II:

- 1) Temperatura de reacción de 90 a 100° C
- 2) Fuente de Al usada en una cantidad de 1 a 2 equivalentes en base a amina
- 5 3) Cianoguanidina usada en una cantidad de 1 a 2 equivalentes en base a amina

Abreviaturas para la tabla II:

-O-i-Pr = isopropilo

Bz = bencilo

NHBz = bencilamino

5 NBz2 = dibencilamino

$$\begin{array}{c}
 \text{Y} \quad \text{X} \\
 \diagdown \quad \diagup \\
 \text{N} \quad \text{Al}^- \quad \text{N}^+ \quad \text{R}^6 \\
 \diagup \quad \diagdown \quad \diagup \quad \diagdown \\
 \text{R}^2 \text{---} \text{C} = \text{N} \quad \text{C} = \text{N} \text{---} \text{R}^3 \\
 \diagdown \quad \diagup \quad \diagdown \quad \diagup \\
 \text{R}^1 \quad \text{R}^5 \quad \text{R}^4
 \end{array} \quad (I)$$
$$\begin{array}{c}
 Y^+ \quad X^+ \\
 \diagdown \quad \diagup \\
 N \quad Al^+ \\
 || \quad || \\
 C \quad N^+ - R^{6+} \\
 | \quad | \\
 -N \quad C \quad N \quad C \quad N-R^{3+} \\
 | \quad | \quad | \quad | \\
 R^{2+} \quad R^{5+} \quad R^{4+}
 \end{array}
 \quad (I^*)$$

48

(v) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆) y alquil (C₁-C₆)-tio, en las que cada uno de los últimos 4 radicales está sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), arilo y ariloxi,

en las que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

(vi) cicloalcoxi (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆),

(vii) ariloxi que está no sustituido o sustituido, y

(viii) aciloxi, aciltio o acilamino, o

X y Y juntos son un grupo divalente de fórmula -U¹-D*-U²- en la que

D* es un puente hidrocarburo, opcionalmente interrumpido con uno o más grupos divalentes de fórmula U³ definida anteriormente, y

U¹, U² y U³, independientemente uno de otro se seleccionan del grupo que consiste en NH, NR', O y S, en la que

R' es alquilo (C₁-C₆), hidroxilo-alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), o

X es un radical como se define anteriormente e Y es un ligando orgánico basado en un compuesto de fórmula Y'-H, Y'-R¹ o R¹-U³-D*-U⁴-R^{LL} en la que D* es un grupo divalente como se definió para el grupo D* anteriormente, Y' es un radical como se definió para Y, U³ es un grupo divalente como se definió para U¹ anteriormente, U⁴ es un grupo divalente como se definió para U² anteriormente, cada uno de R¹ y R^{LL} es un grupo radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₆), hidroxilo-alquilo (C₁-C₆), o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en la que el ligando orgánico está coordinado con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre de un heteroátomo contenido en el mismo y seleccionado del grupo que consiste en N, O y S,

o

X y Y juntos son un radical de fórmula -U¹-D*-U²-R^{LLL}, en la que U¹, U² y D* son como se definieron anteriormente, y R^{LLL} es un radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₆), hidroxilo-alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en la que el radical -U¹-D*-U²-R^{LLL} está coordinado adicionalmente con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre localizado en un heteroátomo contenido en el radical (posición representada por Y).

2. Compuesto como se reivindica en la reivindicación 1, **caracterizado porque**

R¹ es alquilo (C₁-C₁₈), alqueno (C₂-C₁₈) o alquino (C₂-C₁₈), en los que cada uno de los tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{1a}, -S-R^{1b}, -S(=O)-R^{1c}, -S(=O)₂-R^{1d}, -NR^{1e}R^{1f}, -C(=O)-NHR^{1g}, -C(=O)-NR^{1h}R¹ⁱ, -NHC(=O)-NR^{1j}R^{1k} y A^{1a}, en las que R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^{1f}, R^{1g}, R^{1h}, R¹ⁱ, R^{1j}, y R^{1k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{1b}, o es un grupo de fórmula A¹ o B¹,

R² es H, alquilo (C₁-C₁₈), alqueno (C₂-C₁₈) o alquino (C₂-C₁₈), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{2a}, -S-R^{2b}, -S(=O)-R^{2c}, -S(=O)₂-R^{2d}, -NR^{2e}R^{2f}, -C(=O)-NHR^{2g}, -C(=O)-NR^{2h}R²ⁱ, -NHC(=O)-NR^{2j}R^{2k} y A^{2a}, en las que R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{2e}, R^{2f}, R^{2g}, R^{2h}, R²ⁱ, R^{2j}, y R^{2k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{2b}, o es un grupo de fórmula A²,

R³ es H, alquilo (C₁-C₁₈), alqueno (C₂-C₁₈) o alquino (C₂-C₁₈), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{3a}, -S-R^{3b}, -S(=O)-R^{3c}, -S(=O)₂-R^{3d}, -NR^{3e}R^{3f}, -C(=O)-NHR^{3g}, -C(=O)-NR^{3h}R³ⁱ, -NHC(=O)-NR^{3j}R^{3k} y A^{3a}, en los que R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R^{3e}, R^{3f}, R^{3g}, R^{3h}, R³ⁱ, R^{3j}, y R^{3k},

independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{3b}, o es un grupo de fórmula A³,

R⁴ es H, alquilo (C₁-C₁₈), alqueno (C₂-C₁₈) o alquino (C₂-C₁₈), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{4a}, -S-R^{4b}, -S(=O)-R^{4c}, -S(=O)₂-R^{4d}, -NR^{4e}R^{4f}, -C(=O)-NHR^{4g}, -C(=O)-NR^{4h}R⁴ⁱ, -NHC(=O)-NR^{4j}R^{4k} y A^{4a}, en las que R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}, R^{4d}, R^{4e}, R^{4f}, R^{4g}, R^{4h}, R⁴ⁱ, R^{4j}, y R^{4k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{4b}, o es un grupo de fórmula A⁴,

R⁵ es H, alquilo (C₁-C₁₈), alqueno (C₂-C₁₈) o alquino (C₂-C₁₈), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{5a}, -S-R^{5b}, -S(=O)-R^{5c}, -S(=O)₂-R^{5d}, -NR^{5e}R^{5f}, -C(=O)-NHR^{5g}, -C(=O)-NR^{5h}R⁵ⁱ, -NHC(=O)-NR^{5j}R^{5k} y A^{5a}, en las que R^{5a}, R^{5b}, R^{5c}, R^{5d}, R^{5e}, R^{5f}, R^{5g}, R^{5h}, R⁵ⁱ, R^{5j}, y R^{5k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{5b}, o es un grupo de fórmula A⁵,

R⁶ es H, alquilo (C₁-C₁₈), alqueno (C₂-C₁₈) o alquino (C₂-C₁₈), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{6a}, -S-R^{6b}, -S(=O)-R^{6c}, -S(=O)₂-R^{6d}, -NR^{6e}R^{6f}, -C(=O)-NHR^{6g}, -C(=O)-NR^{6h}R⁶ⁱ, -NHC(=O)-NR^{6j}R^{6k} y A^{6a}, en las que R^{6a}, R^{6b}, R^{6c}, R^{6d}, R^{6e}, R^{6f}, R^{6g}, R^{6h}, R⁶ⁱ, R^{6j}, y R^{6k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{6b}, o es un grupo de fórmula A⁶, o

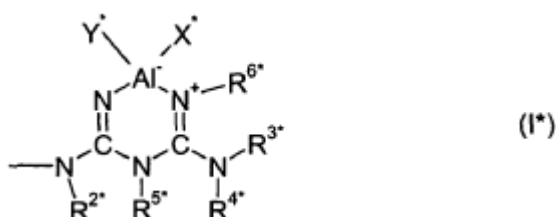
R¹ y R² o R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido a cada uno de los otros forma un anillo N-heterocíclico que presenta de 3 a 7 átomos de anillo y de forma opcional presenta uno o más heteroátomos adicionales seleccionados del grupo que consiste en N, O y S y que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfino, haloalquil (C₁-C₆)-sulfino, alquil (C₁-C₆)-sulfono, haloalquil (C₁-C₆)-sulfono, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo y oxo,

A¹, A^{1a}, A^{1b}, A², A^{2a}, A^{2b}, A³, A^{3a}, A^{3b}, A⁴, A^{4a}, A^{4b}, A⁵, A^{5a}, A^{5b}, A⁶, A^{6a}, y A^{6b}, independientemente unos de otros, son cicloalquilo (C₃-C₉), cicloalqueno (C₄-C₉), cicloalquino (C₅-C₉), arilo o heterocíclico como un resto cíclico básico, en el que el resto cíclico básico

(a) está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfino, haloalquil (C₁-C₆)-sulfino, alquil (C₁-C₆)-sulfono, haloalquil (C₁-C₆)-sulfono, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino, y en caso de heterocíclico, también oxo unido a átomos de heteroanillo de N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o

(b) está sustituido con o sustituido adicionalmente con uno o más de los sustituyentes citados en (a) por un puente unido geminalmente (una posición 1,1), vicinalmente (una posición 1,2) o en una posición 1,3 en el resto cíclico básico formando de este modo otro anillo carbocíclico o heterocíclico junto con la parte del resto cíclico básico entre los átomos unidos al puente, estando el anillo carbocíclico o heterocíclico formado saturado, parcialmente insaturado, insaturado, aromático o heteroaromático y en el que el puente está no sustituido o sustituido adicionalmente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfino, haloalquil (C₁-C₆)-sulfino, alquil (C₁-C₆)-sulfono, haloalquil (C₁-C₆)-sulfono, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino,

B¹ es un grupo como se define para R¹ unido adicionalmente al grupo amino del grupo de fórmula (I*)



en la que R^{2*} , R^{3*} , R^{4*} , R^{5*} , X^* e Y^* son independientemente como se definen en la fórmula (I) para R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X e Y , respectivamente,

X e Y cada uno, independientemente uno de otro, se seleccionan del grupo que consiste en

(i) amino,

- 5 (ii) un grupo de fórmula NR^7R^8 en la que R^7 es un radical seleccionado del grupo que consiste en radicales como se definen para e independientemente de R^1 , y en la que R^8 es un radical seleccionado del grupo que consiste en radicales como se definen para e independientemente de R^2 ,

(iii) hidroxilo,

(iv) alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6) y alquil (C_1-C_6)-tio,

- 10 (v) alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6) y alquil (C_1-C_6)-tio, en los que cada uno de los últimos 4 radicales está sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_6),

en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), arilo y ariloxi,

- 15

en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino,

- 20

(vi) cicloalcoxi (C_3-C_6) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6),

- 25 (vii) ariloxi que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino,

- 30

y

(viii) aciloxi, aciltio o acilamino, que presenta cada uno de 1 a 12 átomos de carbono,

o

- 35 X e Y juntos son un grupo divalente de fórmula $-U^1-D^*-U^2-$ en la que

D^* es un puente alquilenilo lineal, un puente alquilenilo (C_2-C_{10}) lineal, un puente alquilenilo (C_2-C_{10}) lineal, un puente cicloalquilenilo (C_3-C_9), un puente fenileno o un puente que consiste en una combinación de dos o más de dichos restos acíclicos y cíclicos lineales que presentan en total de 4 a 24 átomos de carbono, en el que el puente en cada caso está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_6)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino, y

- 40

- 45 U^1 , U^2 y U^3 , independientemente uno de otro se seleccionan del grupo que consiste en NH, NR' , O y S, en la que

R' es alquilo (C_1-C_6), hidroxilo-alquilo (C_1-C_6) o alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), o

X es un radical como se define anteriormente e Y es un ligando orgánico basado en un compuesto de fórmula $Y'-H$, $Y'-R^L$ o $R^L-U^3-D^{**}-U^4-R^{LL}$ en la que D^{**} es un grupo divalente como se definió para el grupo D^* anteriormente, Y' es un radical como se definió para Y, U^3 es un grupo divalente como se definió para U^1 anteriormente, U^4 es un grupo divalente como se definió para U^2 anteriormente, cada uno de R^L y R^{LL} es un grupo radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C_1-C_6), hidroxilo-alquilo (C_1-C_6), o alcoxi (C_1-C_6)-

- 50

alquilo (C₁-C₆), y en el que el ligando orgánico está coordinado con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre de un heteroátomo contenido en el mismo y seleccionado del grupo que consiste en N, O y S,

o

- 5 X e Y juntos son un radical de fórmula -U¹-D*-U²-R^{LLL}, en la que U¹, U² y D* son como se definieron anteriormente, y R^{LLL} es un radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), y en la que el radical -U¹-D*-U²-R^{LLL} está coordinado adicionalmente con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre localizado en un heteroátomo contenido en el radical (posición representada por Y), preferiblemente localizado en el heteroátomo del grupo divalente U².

10 3. Compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 ó 2, **caracterizado porque**

R¹ es alquilo (C₁-C₁₂), alqueno (C₂-C₁₂) o alquino (C₂-C₁₂), en los que cada uno de los tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxi, nitro, carbamoilo, sulfo y radicales de fórmulas -O-R^{1a}, -S-R^{1b}, -S(=O)-R^{1c}, -S(=O)₂-R^{1d}, -NR^{1e}R^{1f}, -C(=O)-NHR^{1g}, -C(=O)-NR^{1h}R¹ⁱ, -NHC(=O)-NR^{1j}R^{1k} y A^{1a}, en las que R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^{1f}, R^{1g}, R^{1h}, R¹ⁱ, R^{1j}, y R^{1k}, independientemente unos de otros, son alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o un radical de fórmula A^{1b}, o es un grupo de fórmula A¹ o B¹, o

R¹ y R² junto con el átomo de N unido a cada uno de los otros forma un anillo N-heterocíclico que presenta 5 ó 6 átomos de anillo y de forma opcional presenta 1, 2 ó 3 heteroátomos adicionales seleccionados del grupo que consiste en N, O y S y que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxi, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino, di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino y oxo,

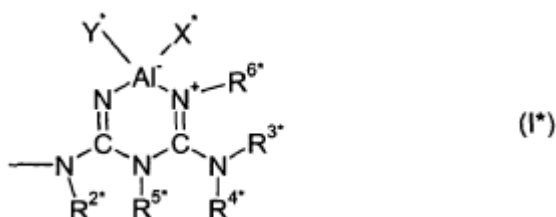
25 A¹, A^{1a} y A^{1b}, independientemente uno de otro, son cicloalquilo (C₃-C₉), cicloalqueno (C₄-C₉), cicloalquino (C₅-C₉), arilo o heterociclilo como un resto cíclico básico, en el que el resto cíclico básico

(a) está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxi, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino, y en caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo de N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o

(b) está sustituido con o sustituido adicionalmente con uno o más de los sustituyentes citados en (a) por un puente unido geminalmente (una posición 1,1), vicinalmente (una posición 1,2) o en una posición 1,3 en el resto cíclico básico formando de este modo otro anillo carbocíclico o heterocíclico junto con la parte del resto cíclico básico entre los átomos unidos al puente, presentando el anillo carbocíclico o heterocíclico formado saturado, parcialmente insaturado, insaturado de 3 a 9 átomos de anillo o es aromático o heteroaromático presentando 5 ó 6 átomos de anillo

40 y en el que el puente está no sustituido o sustituido adicionalmente con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxi, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, alquil (C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfinilo, alquil (C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil (C₁-C₆)-sulfonilo, di[(alquil (C₁-C₄))-amino, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C₁-C₄))-amino-carbonilamino, y en caso de heterociclilo, también oxo unido a átomos de heteroanillo de N o S o en posición alfa de un átomo de N como átomo de heteroanillo, o está adicionalmente benzocondensado en el que el anillo de benceno condensado adicional está no saturado o saturado con uno o más radicales como se definen para sustitución del puente que está benzocondensado,

B¹ es un grupo como se define para R¹ unido adicionalmente al grupo amino del grupo de fórmula (I*)



en la que R^{2*} , R^{3*} , R^{4*} , R^{5*} , R^{6*} , X^* e Y^* son independientemente como se definen en la fórmula (I) para R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , X e Y , respectivamente.

4. Compuesto como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizado porque**

5 R^2 es H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_4) o alquinilo (C_2-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), fenilo, naftilo, fenil-alquilo (C_1-C_4) o cicloalquilo (C_3-C_6), en los que cada uno de estos 4 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico con uno o más radicales como se definen para sustituyentes en el grupo cíclico A^2 , y R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son cada uno H,

5. Compuesto como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, **caracterizado porque** X e Y, independientemente uno de otro, se seleccionan del grupo que consiste en

10 (i) amino,

(ii) un grupo de fórmula NR^7R^8 en la que se define como el grupo NR^1R^2 en la fórmula (I),

(iii) hidroxilo,

(iv) alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

15 (v) alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, en los que cada uno de los últimos 4 radicales está sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_6),

en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), fenilo o fenoxi,

20 en los que cada uno de los 2 radicales recién citados está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino], alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo], alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino],

25 (vi) cicloalcoxi (C_3-C_6) que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, carbamoilo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), y

30 (vii) fenoxi que está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino], alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo], alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino],

35 y

(viii) aciloxi, aciltio o acilamino, en el que acilo en los tres grupos recién citados es formilo, alquil (C_1-C_6)-carbonilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo o fenilsulfonilo,

40 estando este último no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o

45 X e Y juntos son un grupo divalente de fórmula $-O-D^*-O-$, $-S-D^*-S-$, $-NH-D^*-NH-$, $-O-D^*-NH-$, $-O-D^*-S-$, $-N(CH_3)-D^*-N(CH_3)-$, $-NH-D^*-N(CH_3)-$, $-N(C_2H_5)-D^*-N(C_2H_5)-$ o $-NH-D^*-N(C_2H_5)-$, en las que D^* en cada uno de los 9 grupos divalentes recién citados es un puente alquileno lineal, un puente alquenileno (C_2-C_{10}) lineal, un puente alquinileno (C_2-C_{10}) lineal, un puente cicloalquileno (C_3-C_9), un puente fenileno o un puente que consiste en una combinación de dos o más de dichos restos acíclicos y cíclicos lineales que presentan en total de 4 a 18 átomos de carbono, en el que el puente en cada caso está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, nitro, carbamoilo, sulfo, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfonilo, di[(alquil (C_1-C_4))-amino], alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilo, di-[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilo], alquil (C_1-C_4)-amino-carbonilamino y di[(alquil (C_1-C_4))-amino-carbonilamino], o

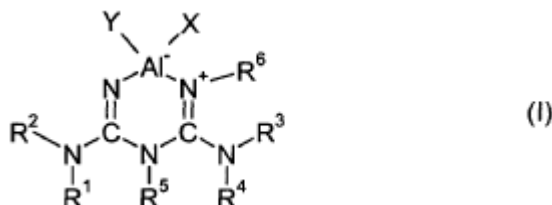
50

X es un radical como se definió anteriormente e Y es un ligando orgánico basado en un compuesto de fórmula $Y'-H$, $Y'-R^L$ o $R^L-O-D^{**}-O-R^{LL}$, $R^L-S-D^{**}-S-R^{LL}$, $R^L-NH-D^{**}-NH-R^{LL}$, $R^L-O-D^{**}-NH-R^{LL}$, $R^L-O-D^{**}-S-R^{LL}$, $R^L-N(CH_3)-D^{**}-N(CH_3)-R^{LL}$, $R^L-NH-D^{**}-N(CH_3)-R^{LL}$, $R^L-N(C_2H_5)-D^{**}-N(C_2H_5)-R^{LL}$ o $R^L-NH-D^{**}-N(C_2H_5)-R^{LL}$, en la que D^{**} en cada uno de los 9 compuestos recién citados es un grupo divalente como se definió para el grupo D^* anteriormente, Y' es un radical como se definió para Y, y cada uno de R^L y R^{LL} es un grupo radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C_1-C_6), hidroxi-alquilo (C_1-C_6), o alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), y en el que el ligando orgánico está coordinado con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre de un heteroátomo contenido en el mismo y seleccionado del grupo que consiste en N, O y S,

o

X e Y juntos son un radical de fórmula $-O-D^{**}-O-R^{LLL}$, $-S-D^{**}-S-R^{LLL}$, $-NH-D^{**}-NH-R^{LLL}$, $-O-D^{**}-NH-R^{LLL}$, $-NH-D^{**}-O-R^{LLL}$, $-O-D^{**}-S-R^{LLL}$, $-S-D^{**}-O-R^{LLL}$, $-N(CH_3)-D^{**}-N(CH_3)-R^{LLL}$, $-NH-D^{**}-N(CH_3)-R^{LLL}$, $-N(CH_3)-D^{**}-NH-R^{LLL}$, $-N(C_2H_5)-D^{**}-N(C_2H_5)-R^{LLL}$, $-NH-D^{**}-N(C_2H_5)-R^{LLL}$ o $-N(C_2H_5)-D^{**}-NH-R^{LLL}$, en las que D^* en los 13 radicales recién citados es como se definió anteriormente, y R^{LLL} es un radical seleccionado del grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4), hidroxi-alquilo (C_1-C_4) o alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), y en los que el radical está coordinado adicionalmente con el átomo de aluminio del complejo mediante un par de electrones libre localizado en un heteroátomo contenido en el radical (posición representada por Y), preferiblemente localizado en el heteroátomo unido al grupo R^{LLL} en el grupo divalente.

6. Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) o sales del mismo de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5,

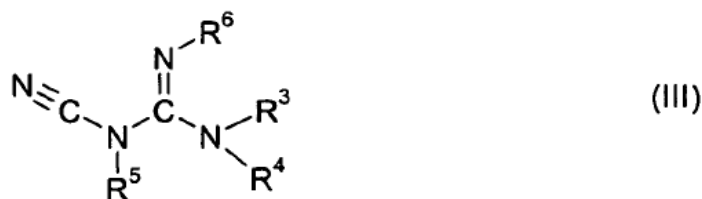


en la que R^1 a R^6 y X e Y son como se definieron en la fórmula (I),

caracterizado porque un compuesto (una amina) de fórmula (II) o una sal del mismo,



en la que R^1 y R^2 se definen como en el compuesto de fórmula (I) a preparar, se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (III) o sales del mismo,



en la que R^3 , R^4 , R^5 y R^6 se definen como en el compuesto de fórmula (I) a preparar, y una fuente de aluminio (III), opcionalmente, en presencia de un aditivo o disolvente práctico seleccionado del grupo que consiste en alcoholes o aminas.

7. Procedimiento como se reivindica en la reivindicación 6, **caracterizado porque** la fuente de aluminio (III) seleccionada de

(i) sales de aluminio de fórmula (IV),



en la que

X e Y son como se definieron en el compuesto de fórmula (I) que se va a preparar, y Z, independientemente de X, es un grupo saliente seleccionado del grupo de radicales como se definieron para X ó Y, o

(ii) sales de aluminio de fórmula (IV'),



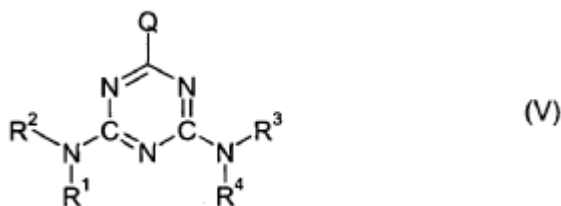
5 en la que

X', Y' y Z' se seleccionan cada uno del grupo que consiste en radicales como se definieron para X, Y o Z, respectivamente y radicales que generan dicho grupo X, Y o Z, respectivamente en presencia de un aditivo o disolvente prótico X-H, Y-H o Z-H, respectivamente, con la condición de que 1, 2 ó 3 de los radicales X', Y' y Z' se seleccionen de dichos radicales que generan radicales X, Y y Z, respectivamente,

10 en combinación con un aditivo o disolvente prótico X-H, Y-H o Z-H en las que cada uno de X, Y y Z se definen como se describe para X e Y en fórmula (1).

8. Uso de un compuesto de fórmula (I) o sales del mismo como se define en la reivindicación 1 para la preparación de compuestos heterocíclicos que corresponden a la fórmula (I), en la que el grupo de aluminio Al(X)(Y) está reemplazado con un átomo de carbono opcionalmente sustituido o derivados de s-triazina del mismo.

15 9. Un procedimiento de preparación de compuestos de fórmula (V) o sales del mismo,



en la que

20 R¹, R², R³ y R⁴ son como se definieron en la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, y

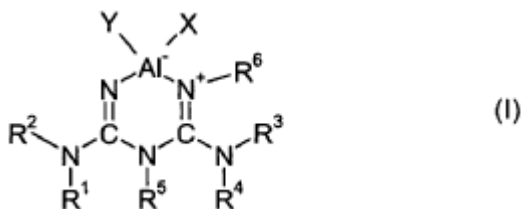
Q es

a) hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₂), alqueno (C₂-C₁₂) o alquino (C₂-C₁₂), en los que cada uno de estos tres radicales recién citados está no sustituido o sustituido,

25 b) o es cicloalquilo (C₃-C₆), benzo-cicloalquilo (C₅-C₆), cicloalqueno (C₅-C₆), benzo-cicloalqueno (C₅-C₆), fenilo, naftilo, heterociclilo, heterociclilo benzocondensado, en los que cada uno de los 8 radicales recién citados está no sustituido o sustituido en el resto cíclico,

c) o es COR, COOR, C(=S)R, C(=O)SR, C(=S)OR, C(=S)SR, en las que R en cada una de los 6 radicales recién citados es alquilo (C₁-C₁₈), cicloalquilo (C₃-C₆) o fenilo, estando los últimos tres radicales no sustituidos o sustituidos,

30 **caracterizado porque** un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo



en la que

R¹, R², R³ y R⁴ son como se definieron en el compuesto de fórmula M a preparar y R⁵ y R⁶ son hidrógeno, se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VI)

35 Q-W* (VI)

en la que

Q es como se definió en el compuesto de fórmula (V) que se va a preparar y

5 W^{*} es un átomo de carbono que porta 3 enlaces adicionales con 1, 2 ó 3 grupos salientes que están unidos por heteroátomos,

para dar el compuesto de fórmula (V) o una sal del mismo.

10. Procedimiento como se reivindica en la reivindicación 9, **caracterizado porque** el compuesto (I) se prepara de acuerdo con el procedimiento de la reivindicación 6 ó 7 y se usa directamente sin aislamiento para la preparación del compuesto de fórmula (V), de forma opcional en un procedimiento en una etapa.