

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 382 481**

51 Int. Cl.:
C07D 401/14 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/76 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)
C07D 451/06 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **07806284 .1**
96 Fecha de presentación: **29.08.2007**
97 Número de publicación de la solicitud: **2050745**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **22.04.2009**

54 Título: **Compuesto de N-piridilpiperidina, método para producir el mismo, y agente de control de plagas**

30 Prioridad:
01.09.2006 JP 2006237557
06.04.2007 JP 2007100825

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
08.06.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
08.06.2012

73 Titular/es:
Otsuka AgriTechno Co., Ltd
2-2 Kanda Tsukasa-machiChiyoda-kuTokyo
101-0048 , JP

72 Inventor/es:
ENDO, Yasuhiro;
UENAKA, Go y
SHIRAI, Yuichi

74 Agente/Representante:
Curell Aguilá, Mireia

ES 2 382 481 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto de N-piridilpiperidina, método para producir el mismo, y agente de control de plagas.

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un compuesto de N-piridilpiperidina, a un método para producir el mismo, y a un agente de control de plagas que lo usa.

10 **Antecedentes de la técnica**

Se conocen diversos compuestos en los que el átomo de nitrógeno de piperidina está sustituido con un grupo piridilo. Entre ellos, los compuestos que tienen un grupo fenoxi en la posición 4 del anillo de piperidina son conocidos por tener actividad contra ácaros (véase el Documento 1 de Patente).

15 El compuesto descrito en el Documento 1 de Patente muestra un excelente efecto contra ácaros frente a ácaros araña, pero no tiene un efecto suficiente sobre ácaros enroñadores (véase el Ensayo 1 Comparativo descrito más abajo).

20 Generalmente, los ácaros desarrollan con mucha probabilidad resistencia a productos químicos. De hecho, muchos acaricidas comercialmente disponibles se han hecho ineficaces. En años recientes, los ácaros, particularmente ácaros enroñadores, han provocado un daño grave. Sin embargo, actualmente se sabe que sólo unos pocos tipos de productos químicos son eficaces frente a ácaros enroñadores; además, algunos de estos productos químicos se han hecho ineficaces debido a que los ácaros enroñadores desarrollan resistencias a ellos. En tales circunstancias, hay una demanda urgente de desarrollar un nuevo producto químico que muestre una excelente actividad acaricida frente a ácaros enroñadores y ácaros araña.

Documento 1 de Patente: WO 2005/095380

30 **Descripción de la invención**

PROBLEMA A RESOLVER POR LA INVENCIÓN

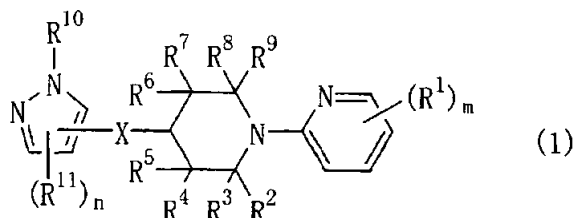
35 Un objeto de la presente invención es proporcionar un nuevo producto químico que muestre una excelente actividad acaricida frente a ácaros enroñadores, así como frente a ácaros araña.

MEDIOS PARA RESOLVER EL PROBLEMA

40 Se ha realizado una intensa investigación para lograr el objeto anterior, y se ha encontrado que un compuesto de piperidina que tiene un anillo de pirazol en la posición 4 del anillo de piperidina vía un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o SO₂, presenta una excelente actividad acaricida frente a ácaros enroñadores y ácaros araña. La presente invención se ha logrado basándose en este hallazgo.

45 La presente invención proporciona un compuesto de N-piridilpiperidina, un procedimiento para producirlo, y un agente de control de plagas que lo usa, como se resume más abajo en los Apartados 1 a 23.

Apartado 1. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



50 (en la que R¹ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄;

55 R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, y R⁹ son cada uno, independientemente, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄;

cada pareja de R² y R⁸, y R⁴ y R⁶ puede unirse para formar un grupo alqueno de C₁₋₄;

5 R^{10} es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo cicloalquilo de C_{3-8} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo alquino de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo haloalqueno de C_{2-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-6} ; un grupo bencilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4}); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C_{3-8} opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxide de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , benciloxi, fenoxi, $-CON(R^{12})(R^{13})$ (en el que R^{12} y R^{13} son cada uno, independientemente, un grupo alquilo de C_{1-4} , o R^{12} y R^{13} pueden unirse para formar un grupo alqueno de C_{2-7}), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C_{1-4});

10 R^{11} es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo hidroxialquilo de C_{1-4} , un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} , un grupo alquilcarbonilo de C_{1-4} , un grupo mono- o di(alquil C_{1-4})aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, $-C(R^{14})=NO(R^{15})$ (en el que R^{14} es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} , y R^{15} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C_{1-4} , o un grupo bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , alquiltio de C_{1-4} , ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4});

15 X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o $-SO_2-$;

20 m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los R^1 pueden ser iguales o diferentes; y

25 n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R^{11} pueden ser iguales o diferentes).

30 Apartado 2. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 1, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1) en la que R^1 es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo ciano, o un grupo nitro.

35 Apartado 3. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 1 ó 2, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R^{10} es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-6} ; un grupo bencilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno y haloalquilo de C_{1-4}); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en formilo, alcoxide de C_{1-6} , fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos.

40 Apartado 4. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según uno cualquiera de los apartados 1 a 3, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R^{11} es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo hidroxialquilo de C_{1-4} , un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} , un grupo formilo, $-C(R^{14})=NO(R^{15})$ (en el que R^{14} es un átomo de hidrógeno, y R^{15} es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4}), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-6} , haloalquilo de C_{1-4} , alcoxide de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , alquiltio de C_{1-4} , ciano, y nitro) o grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más átomos de halógeno).

45 Apartado 5. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según uno cualquiera de los apartados 1 a 4, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que X es un átomo de oxígeno.

50 Apartado 6. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 2, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} o un grupo ciano.

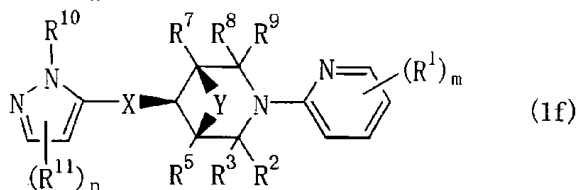
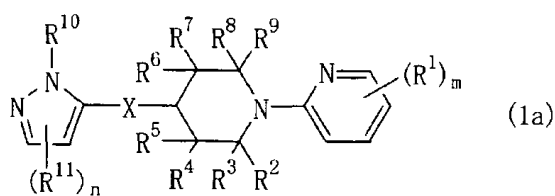
Apartado 7. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 6, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R¹ es un grupo haloalquilo de C₁₋₄.

Apartado 8. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 3, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R¹⁰ es un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alquilo de C₁₋₄ y haloalquilo de C₁₋₄); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos.

Apartado 9. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 8, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R¹⁰ es un grupo alquilo de C₁₋₆; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno y alquilo de C₁₋₄); un grupo piridilo (opcionalmente sustituido en el anillo piridínico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno o independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y 1,3-dioxolan-2-ilo.

Apartado 10. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 4, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R¹¹ es un grupo alquilo de C₁₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₄; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno o independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, y nitro); o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más átomos de halógeno).

Apartado 11. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 1, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1a) o (1f)



(en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, m, y n son como se definen en el apartado 1, e Y es un grupo alqueno de C₁₋₄).

Apartado 12. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 11, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1a) o (1f), en la que R¹ es un grupo haloalquilo de C₁₋₄ o un grupo ciano.

Apartado 13. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 12, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1a) o (1f), en la que R¹⁰ es un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alquilo de C₁₋₄ y haloalquilo de C₁₋₄); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos

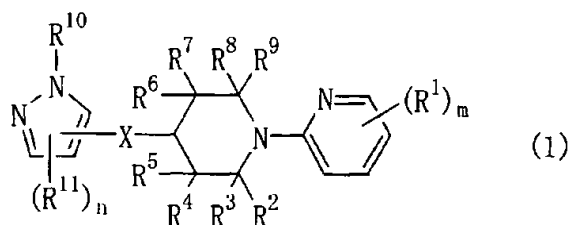
heterocíclicos.

5 Apartado 14. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según el apartado 13, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1a) o (1f), en la que R^{11} es un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , haloalcoxi de C_{1-4} , y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más átomos de halógeno).

10 Apartado 15. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según uno cualquiera de los apartados 11 a 14, en los que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1a), en la que uno cualquiera de R^4 , R^5 , R^6 , y R^7 es un grupo alquilo de C_{1-4} que está situado en trans con respecto al X en la posición 4 del anillo de piperidina.

15 Apartado 16. Un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según uno cualquiera de los apartados 11 a 15, en los que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1a) o (1f) en la que X es un átomo de oxígeno.

20 Apartado 17. Un método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



25 (en la que R^1 es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} ;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , y R^9 son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} ;

30 cada pareja de R^2 y R^8 , y R^4 y R^6 puede unirse para formar un grupo alquileno de C_{1-4} ;

R^{10} es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo cicloalquilo de C_{3-8} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo alquino de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo haloalqueno de C_{2-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-6} ; un grupo benzilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4}); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C_{3-8} opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxi de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , benciloxi, fenoxi, -CON(R^{12})(R^{13}) (en la que R^{12} y R^{13} son cada uno independientemente un grupo alquilo de C_{1-4} , o R^{12} y R^{13} pueden unirse para formar un grupo alquileno de C_{2-7}), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C_{1-4});

45 R^{11} es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo hidroxialquilo de C_{1-4} , un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} , un grupo alquilcarbonilo de C_{1-4} , un grupo mono- o di(alquil C_{1-4})aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, -C(R^{14})=NO(R^{15}) (en la que R^{14} es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} , y R^{15} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C_{1-4} , o un grupo bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-6} , haloalquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , alquilio de C_{1-4} , ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4});

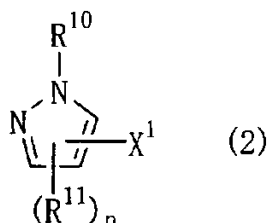
50 X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o -SO₂-;

m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los m R^1 pueden ser iguales o

diferentes;

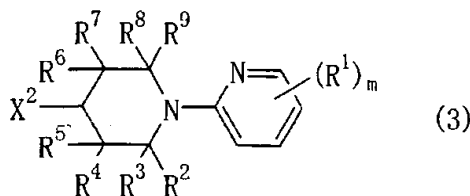
n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R¹¹ pueden ser iguales o diferentes);

5 comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto pirazólico representado mediante la Fórmula (2)



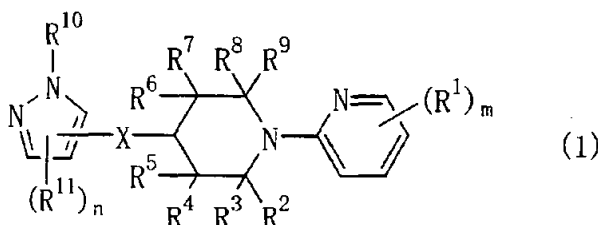
10 (en la que R¹⁰, R¹¹, y n son como se definen anteriormente, X¹ es un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, un grupo trifluorometanosulfonilo, un grupo p-toluenosulfonilo, un grupo metiltio, un grupo metanosulfonilo, un grupo hidroxilo, o un grupo mercapto)

con un compuesto piperídico representado mediante la Fórmula (3)



15 (en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, y m son como se definen anteriormente, y X² es un grupo hidroxilo o un grupo mercapto).

20 Apartado 18. Un método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



25 (en la que R¹ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄;

R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, y R⁹ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄;

30 cada pareja de R² y R⁸, y R⁴ y R⁶ puede unirse para formar un grupo alqueno de C₁₋₄;

R¹⁰ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo cicloalquilo de C₃₋₈; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo alquino de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo haloalqueno de C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₆; un grupo benzilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C₃₋₈ sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxilo de C₁₋₆, haloalcoxilo de C₁₋₄, benciloxi, fenoxi, -CON(R¹²)(R¹³) (en el que R¹² y R¹³ son cada uno independientemente un grupo alquilo de C₁₋₄, o R¹² y R¹³ se pueden unir para formar un grupo alqueno de C₂₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄);

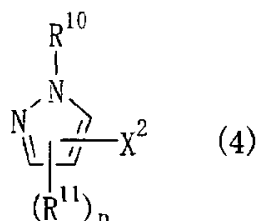
5 R^{11} es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo hidroxialquilo de C_{1-4} , un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} , un grupo alquilcarbonilo de C_{1-4} , un grupo mono- o di(alquil C_{1-4})aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, $-C(R^{14})=NO(R^{15})$ (en la que R^{14} es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} , y R^{15} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C_{1-4} , o un grupo bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4});

X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o $-SO_2-$; y

15 m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los m R^1 pueden ser iguales o diferentes;

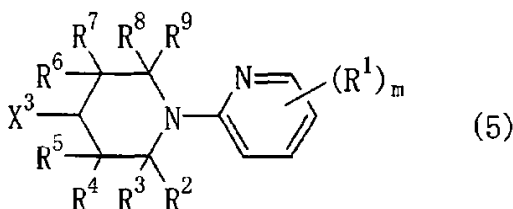
n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R^{11} pueden ser iguales o diferentes);

20 comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto pirazólico representado mediante la Fórmula (4)



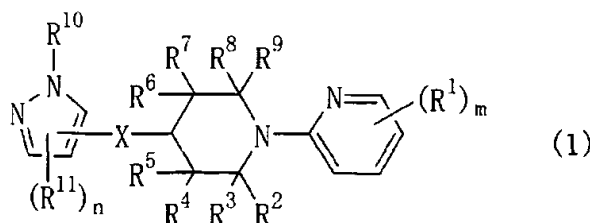
(en la que R^{10} , R^{11} , y n son como se definen anteriormente, y X^2 es un grupo hidroxilo o un grupo mercapto)

25 con un compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (5)



30 (en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , y m son como se definen anteriormente, y X^3 es un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, un grupo trifluorometanosulfonilo, un grupo p-toluenosulfonilo, un grupo metilo, o un grupo metanosulfonilo).

35 Apartado 19. Un método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



40 (en la que R^1 es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} ;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , y R^9 son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} ;

cada pareja de R^2 y R^8 , y R^4 y R^6 puede unirse para formar un grupo alqueno de C_{1-4} ;

R¹⁰ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo cicloalquilo de C₃₋₈; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo alquino de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo haloalqueno de C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₆; un grupo benzilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno o a cinco átomos de halógeno), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en un átomo de halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C₃₋₈ opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxide de C₁₋₆, haloaloxi de C₁₋₄, benciloxi, fenoxi, -CON(R¹²)(R¹³) (en el que R¹² y R¹³ son cada uno independientemente un grupo alquilo de C₁₋₄, y R¹² y R¹³ pueden unirse para formar un grupo alqueno de C₂₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄);

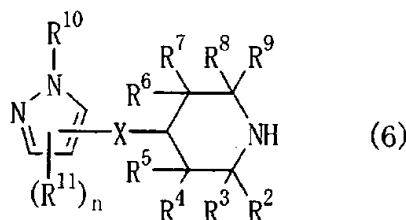
R¹¹ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo hidroxialquilo de C₁₋₄, un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄, un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₄, un grupo mono- o di(alquilo C₁₋₄)aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, -C(R¹⁴)=NO(R¹⁵) (en el que R¹⁴ es hidrógeno o alquilo de C₁₋₄, y R¹⁵ es hidrógeno, alquilo de C₁₋₄, o bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₄, alcoxide de C₁₋₆, haloaloxi de C₁₋₄, alquilo de C₁₋₄, ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄);

X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o -SO₂-;

m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los m R¹ pueden ser iguales o diferentes;

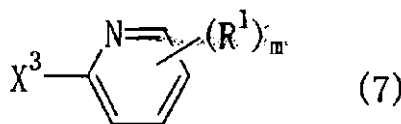
n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R¹¹ pueden ser iguales o diferentes);

comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (6)



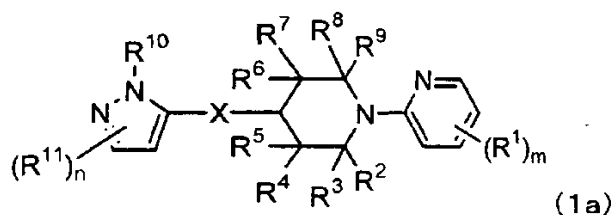
(en la que R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, y n son como se definen anteriormente)

con un compuesto piridínico representado mediante la Fórmula (7)



(en la que R¹, X³, y m son como se definen anteriormente).

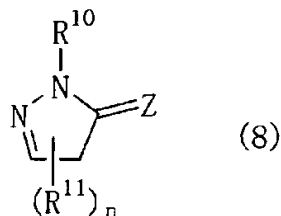
Apartado 20. Un método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1a)



(en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, m, y n son como se definen en el apartado 1);

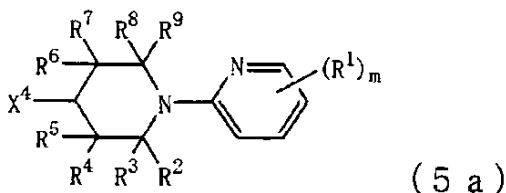
comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto de pirazolona representado mediante la Fórmula (8)

5



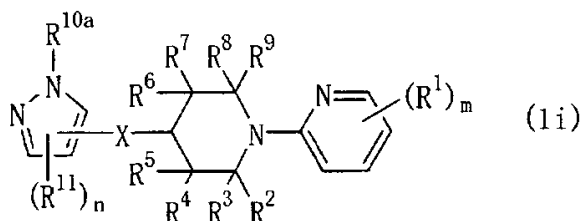
(en la que R¹⁰, R¹¹, y n son como se definen anteriormente, y Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre)

10 con un compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (5a)



15 (en la que R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, y m son como se definen anteriormente, X⁴ es X² o X³, y X² y X³ son como se definen anteriormente).

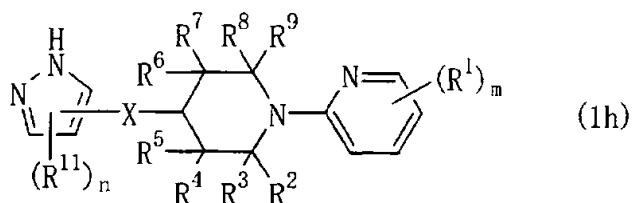
Apartado 21. Un método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1i)



20

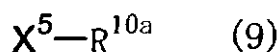
(en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹¹, X, m, y n son como se definen en el apartado 1; R^{10a} es un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo cicloalquilo de C₃₋₆; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo alquino de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo haloalqueno de C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo alcocarbonilo de C₁₋₆; un grupo benzilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C₃₋₈ opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₄, benciloxi, fenoxi, -CON(R¹²)(R¹³) (en el que R¹² y R¹³ son cada uno independientemente un grupo alquilo de C₁₋₄, y R¹² y R¹³ pueden unirse para formar un grupo alqueno de C₂₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄);

35 comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1h)



(en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{11}, x, m$ y n son como se definen en el apartado 1)

5 con un compuesto representado mediante la Fórmula (9)



(en la que R^{10a} es como se define anteriormente, y X^5 es un átomo de halógeno).

10 Apartado 22. Un agente de control de plagas, que comprende como principio activo el compuesto de N-piridilpiperidina, N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos de uno cualquiera de los apartados 1 a 16.

15 Apartado 23. Un agente de control de plagas según el apartado 22, que es un acaricida.

Los grupos citados en la presente memoria descriptiva se describen más abajo.

Los ejemplos del átomo de halógeno son átomos de flúor, cloro, bromo, y yodo.

20 Los ejemplos del grupo haloalquilo de C_{1-4} incluyen grupos alquilo lineales o ramificados, que tienen 1 a 4 átomos de carbono y que están sustituidos con 1 a 9, preferentemente 1 a 5, átomos de halógeno. Los ejemplos específicos del mismo incluyen fluorometilo, clorometilo, bromometilo, yodometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorodifluorometilo, bromodifluorometilo, diclorofluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, 2-bromoetilo, 2-yodoetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 1-fluoroisopropilo, 3-fluoropropilo, 3-cloropropilo, 3-bromopropilo, 4-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4,4,4-trifluorobutilo, y grupos similares.

25 Los ejemplos del grupo alcocarbonilo de C_{1-4} incluyen grupos formados por la unión de un grupo alcoxil lineal o ramificado que tiene 1 a 4 átomos de carbono a un grupo carbonilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n-propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, n-butoxycarbonilo, sec-butoxycarbonilo, terc-butoxycarbonilo, y grupos similares.

Los ejemplos del grupo alquilo de C_{1-4} incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono, tales como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, y terc-butilo.

35 Los ejemplos del grupo alquileo de C_{1-4} incluyen grupos alquileo lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono, tales como metileno, etileno, trimetileno, tetrametileno, propileno, y etiltileno.

40 Los ejemplos del grupo alquilo de C_{1-6} incluyen grupos alquileo lineales o ramificados que tienen 1 a 6 átomos de carbono, tales como n-pentilo, isopentilo, neopentilo, terc-pentilo, n-hexilo, isohexilo, y 2-etil-n-butilo, además de los mencionados como ejemplos del grupo alquilo de C_{1-4} .

45 Los ejemplos del grupo alquilo de C_{1-20} incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen 1 a 20 átomos de carbono, tales como n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo, n-dodecilo, n-tridecilo, n-tetradecilo, n-pentadecilo, n-hexadecilo, n-heptadecilo, n-octadecilo, n-nonadecilo, y n-icosilo, además de los mencionados como ejemplos del grupo alquilo de C_{1-4} y el grupo alquilo de C_{1-6} .

Los ejemplos del grupo cicloalquilo de C_{3-8} incluyen grupos alquilo cíclicos que tienen 4 a 8 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, y ciclooctilo.

50 Los ejemplos del grupo alqueno de C_{2-6} incluyen grupos alqueno lineales o ramificados que contienen 2 a 6 átomos de carbono, y que tienen al menos un doble enlace en cualquier posición. Los ejemplos específicos del mismo incluyen vinilo, 1-propenilo, alilo, isopropenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-2-propenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, y grupos similares.

Los ejemplos del grupo alquinilo de C_{2-6} incluyen grupos alquinilo lineales o ramificados que contienen 2 a 6 átomos

de carbono y que tienen al menos un triple enlace en cualquier posición. Los ejemplos específicos del mismo incluyen etinilo, 2-propinilo, 1-metil-2-propinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, y grupos similares.

Los ejemplos del grupo haloalquilo de C_{1-6} incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen 1 a 6 átomos de carbono y están sustituidos con 1 a 13, preferentemente 1 a 7, átomos de halógeno. Los ejemplos específicos del mismo incluyen 5-cloropentilo, 5-fluoropentilo, 6-clorohexilo, y 6-fluorohexilo, además de los mencionados como ejemplos del grupo haloalquilo de C_{1-4} .

Los ejemplos del grupo haloalquilo de C_{2-6} incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen al menos un doble enlace en cualquier posición, y están sustituidos con 1 a 13, preferentemente 1 a 7, átomos de halógeno. Los ejemplos específicos del mismo incluyen 2,2-diclorovinilo, 2,2-dibromovinilo, 3-cloro-2-propenilo, 3,3-difluoro-2-alilo, 3,3-dicloro-2-alilo, 4-cloro-2-butenilo, 4,4,4-trifluoro-2-butenilo, 4,4,4-tricloro-3-butenilo, 5-cloro-3-pentenilo, 6-fluoro-2-hexenilo, y grupos similares.

Los ejemplos del grupo heterocíclico incluyen tienilo, furilo, tetrahydrofurilo, dioxolano, dioxano, pirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolinilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolinilo, pirazolilo, pirazolidinilo, imidazolilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, oxadiazolilo, oxadiazolinilo, tiadiazolinilo, triazolilo, triazolinilo, triazolidinilo, tetrazolilo, tetrazolinilo, piperidilo, dihidropiridilo, tetrahydropiridilo, piperidilo, o xazinilo, dihidroxazinilo, morfolino, tiazinilo, dihidrotiazinilo, tiamorfolino, piridazinilo, dihidropiridazinilo, tetrahydropiridazinilo, hexahidropiridazinilo, oxadiazinilo, dihidrooxadiazinilo, tetrahydrooxadiazinilo, tiadiazolilo, dihidrotiadiazinilo, tetrahydrodiazinilo, pirimidinilo, dihidropirimidinilo, tetrahydroopirimidinilo, hexahidropirimidinilo, pirazinilo, dihidropirazinilo, tetrahydropirazinilo, piperazinilo, triazinilo, dihidrotriazinilo, tetrahydrotriazinilo, hexahidrotriazinilo, tetrazinilo, dihidrotetrazinilo, indolilo, indolinilo, isindolilo, indazolilo, dihidroquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, carbazolilo, benzoxazolilo, benzoxazolinilo, benzisoxazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzotiazolinilo, benzimidazolilo, indazolinilo, quinolinilo, dihidroquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, isoquinolinilo, dihidroisoquinolinilo, tetrahydroisoquinolinilo, piperidolilo, dihidrobenzoxazinilo, cinolinilo, dihidrocinolinilo, tetrahydrocinolinilo, ftalazinilo, dihidroftalazinilo, tetrahydroftalazinilo, quinoxalinilo, dihidroquinoxalinilo, tetrahydroquinoxalinilo, purinilo, dihidrobenzotriazinilo, dihidrobenzotetrazinilo, fenotiazinilo, furanilo, benzofuranilo, benzotienilo, y grupos similares. Estos grupos heterocíclicos incluyen a aquellos sustituidos en cualquier posición sustituible con un grupo oxo o tiocetona. Estos grupos heterocíclicos incluyen además a aquellos opcionalmente sustituidos en cualquier posición sustituible con 1 a 5 (preferentemente 1 a 3) sustituyentes, tales como átomos de halógeno, grupos alquilo de C_{1-4} , grupos haloalquilo de C_{1-4} , grupos heterocíclicos sustituidos (por ejemplo, 3-cloropiridin-2-ilo, 4-trifluorometil-1,3-tiazol-2-ilo, 5-trifluorometilpiridin-2-ilo, etc.).

Entre estos anillos heterocíclicos, son preferibles tienilo, furilo, tetrahydrofurilo, dioxolano, dioxano, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, piridilo, y piperidilo. Son particularmente preferibles tienilo, tetrahydrofurilo, dioxolano, dioxano, tiazolilo, y piridilo.

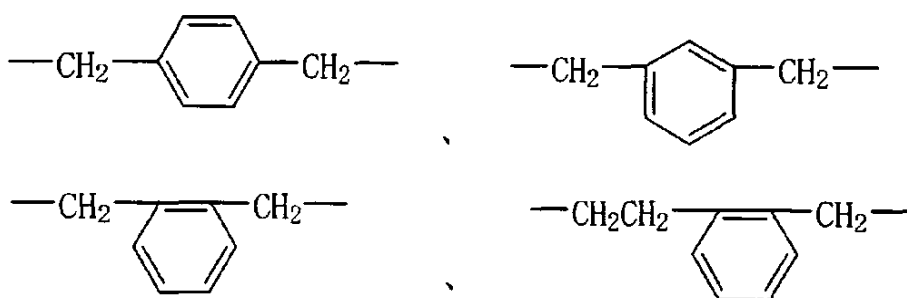
Los ejemplos del grupo cicloalquilo de C_{3-8} opcionalmente sustituido con halógeno incluyen grupos alquilo cíclicos que tienen 3 a 8 átomos de carbono, tales como grupos cicloalquilo de C_{3-8} anteriormente mencionados que están opcionalmente sustituidos en cualquier posición con uno al número máximo sustituible de (preferentemente 1 a 5, y más preferentemente 1 a 3) átomos de halógeno.

Los ejemplos del grupo alcoxi de C_{1-6} incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen 1 a 6 átomos de carbono, tales como metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, ciclopropoxi, n-butoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, n-pentiloxi, isopentiloxi, neopentiloxi, terc-pentiloxi, n-hexiloxi, e isohexiloxi.

Los ejemplos del grupo haloalcoxi de C_{1-4} incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono y están sustituidos con 1 a 9, preferentemente 1 a 5, átomos de halógeno. Los ejemplos específicos del mismo incluyen fluorometoxi, clorometoxi, bromometoxi, yodometoxi, di-clorometoxi, tri-clorometoxi, di-fluorometoxi, trifluorometoxi, clorodifluorometoxi, bromodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi, 1-fluoroisopropoxi, 3-fluoropropoxi, 3-cloropropoxi, 3-bromopropoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, y grupos similares.

Los ejemplos del grupo alquiltio de C_{1-4} incluyen grupos alquiltio lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono, tales como metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, y terc-butiltio.

Los ejemplos del grupo alquileo de C_{2-7} incluyen etileno, trimetileno, tetrametileno, pentametileno, hexametileno, heptametileno, y similares. Estos grupos alquileo pueden contener un átomo de nitrógeno, oxígeno o azufre opcionalmente sustituido o un grupo fenilo. Los ejemplos de tales grupos alquileo incluyen $-CH_2NHCH_2-$, $-CH_2NHCH_2CH_2-$, $-CH_2NHNHCH_2-$, $-CH_2CH_2NHCH_2CH_2-$, $-CH_2NHNHCH_2CH_2-$, $-CH_2NHCH_2NHCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2NHCH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2OCH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$, $-CH_2SCH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2SCH_2CH_2-$,



5 y grupos similares. Estos grupos alquilenos pueden estar sustituidos en cualquier posición o en el átomo de nitrógeno. Los ejemplos de tales sustituyentes incluyen alquilo de C₁₋₄, alcoxycarbonilo de C₁₋₆, hidroxilo, y grupos similares.

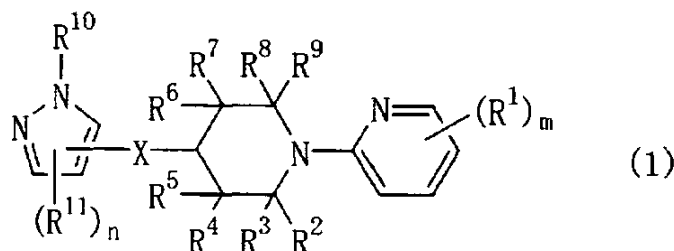
10 Los ejemplos del grupo alquilcarbonilo de C₁₋₄ incluyen grupos alquilcarbonilo lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono, tales como metilcarbonilo (acetilo), etilcarbonilo (propionilo), N-propilcarbonilo (butirilo), isopropilcarbonilo (isobutirilo), n-butilcarbonilo (valerilo), isobutilcarbonilo (isovalerilo), sec-butilcarbonilo, y terc-butilcarbonilo.

15 Los ejemplos del grupo mono- o di- (alquilo C₁₋₄)aminocarbonilo incluyen grupos alquilaminocarbonilo en el que los átomos de nitrógeno de los grupos aminocarbonilo están mono- o disustituidos con grupos alquilo lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono, tales como metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, metiletilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, n-propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, n-butilaminocarbonilo, sec-butilaminocarbonilo, terc-butilaminocarbonilo, y dibutilaminocarbonilo.

20 Los ejemplos del grupo hidroxialquilo de C₁₋₄ incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen 1 a 4 átomos de carbono, y están sustituidos con 1 ó 2 grupos hidroxilo, tales como hidroximetilo, 2-hidroxietilo, 1-hidroxio-2-propilo, 3-hidroxipropilo, 4-hidroxibutilo, y 3,4-dihidroxibutilo.

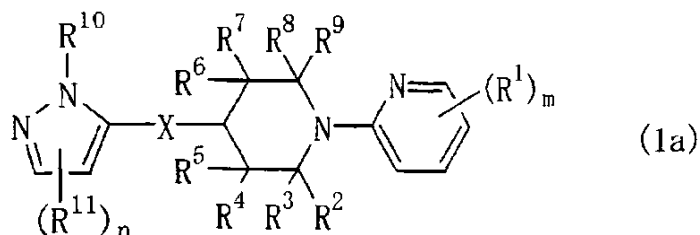
Compuesto de N-piridilpiperidina

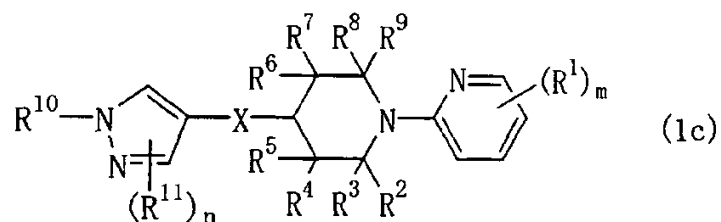
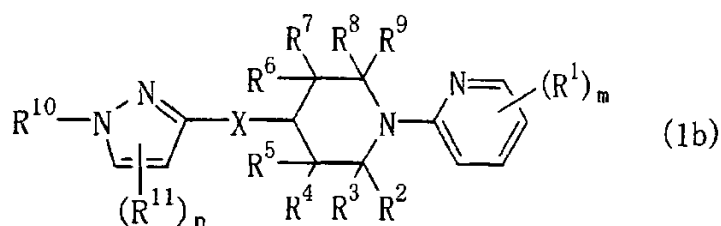
25 El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención se presenta mediante la Fórmula (1) es un compuesto estructuralmente nuevo que tiene un pirazol enlazado a la posición 4 del anillo piperidínico vía un átomo de oxígeno o azufre.



30 (en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, m, y n son como se definen anteriormente).

El compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1) incluye compuestos de N-piridilpiperidina representados mediante las siguientes Formulas (1a), (1b), y (1c).

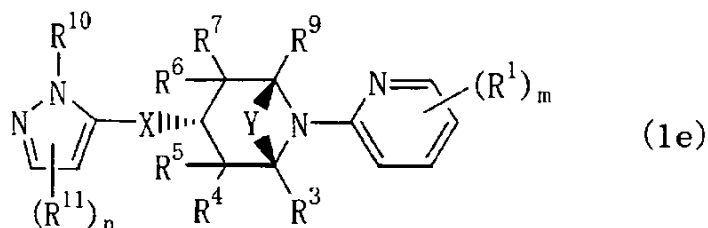
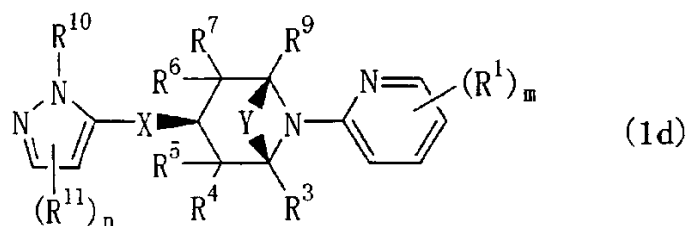




5 (en las que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , X, m, y n son como se definen anteriormente).

El compuesto de N-piridilpiperidina de Formula (1) en la que R^2 y R^8 se unen para formar un grupo alquileo de C_{1-4} puede existir como isómeros cis-trans representados mediante las siguientes Fórmulas (1d) y (1e). El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) incluye tales isómeros.

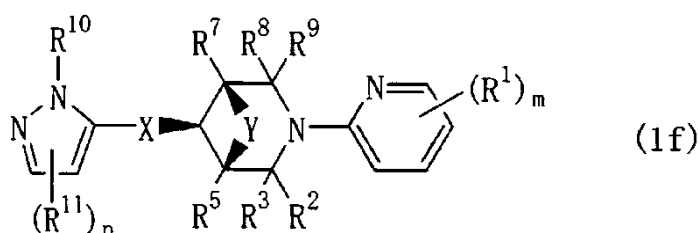
10

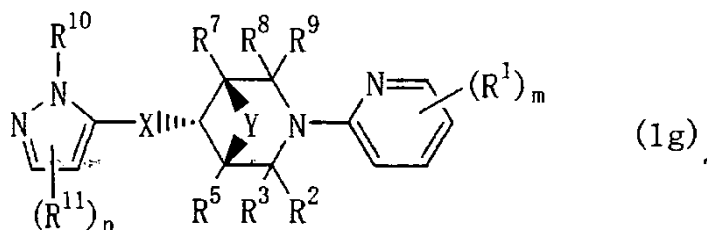


15 (en las que R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , R^{10} , R^{11} , X, m, y n son como se definen anteriormente, e Y es un grupo alquileo de C_{1-4}).

El compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1) en la que R^4 y R^6 se unen para formar un grupo alquileo de C_{1-4} puede existir como isómeros cis-trans representados mediante las Fórmulas (1f) y (1g) más abajo. El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) incluye tales isómeros.

20





(en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , X, Y, m, y n son como se definen anteriormente).

5 El compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1), en la que al menos uno de R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , y R^9 es un grupo alquilo de C_{1-4} , puede existir como estereoisómeros en relación a la posición 4 del anillo piperidínico. El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) incluye tales isómeros.

10 El compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1) puede existir como N-óxidos formados mediante oxidación del nitrógeno del anillo piridínico o del anillo piperidínico del compuesto de N-piridilpiperidina. El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) incluye estos N-óxidos.

15 En esta memoria descriptiva, por conveniencia, el N-óxido formado por la oxidación del nitrógeno en el anillo piridínico se denomina N-óxido de piridilo, mientras que el N-óxido formado por la oxidación del átomo de nitrógeno en el anillo piperidínico se denomina N-óxido de piperidilo.

20 El compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1) tiene propiedades básicas, y por lo tanto puede formar sales con: ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, y ácido fosfórico; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido fumárico, y ácido oxálico; y sales de ácidos tales como hidrogenosulfato de sodio, e hidrogenosulfato de potasio. El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) incluye estas sales.

25 Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante la Fórmula (1), son preferibles aquellos en los que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} o un grupo ciano, y son más preferibles aquellos en los que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} . De manera específica, son particularmente preferibles aquellos en los que R^1 es un grupo trifluorometilo.

30 Entre los compuestos de N-piridilpiperidinas de la invención representados mediante la Fórmula (1) son preferibles aquellos en los que R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4}); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4}); o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxilo de C_{1-6} , fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos. Más preferibles son aquellos en los que R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-6} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno, o grupos alquilo de C_{1-4}); un grupo piridilo (opcionalmente sustituido en el anillo piridínico con uno o más, y preferentemente uno o dos grupos alquilo de C_{1-4}); o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxilo de C_{1-6} , fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y 1,3-dioxolan-2-ilo. Particularmente preferibles son los compuestos en los que R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo piridilo, un grupo 2,2-dimetoxietilo, o un grupo (1,3-dioxolan-2-il)metilo.

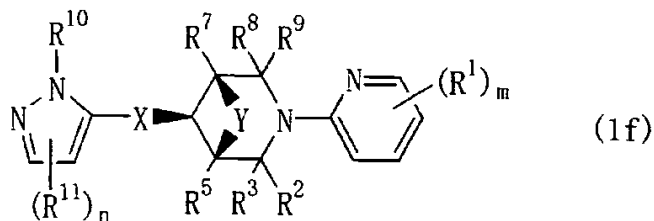
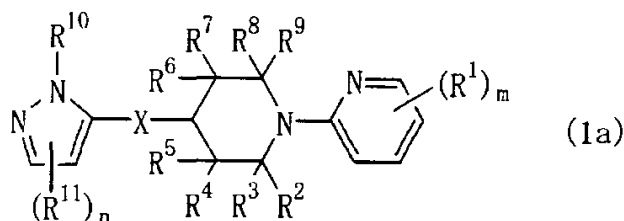
45 Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante la Fórmula (1), son preferibles aquellos en los que R^{11} es un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno a tres sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , nitro, haloalquilo de C_{1-4} , y haloalcoxilo de C_{1-4}), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno). Los compuestos en los que R^{11} es un grupo trifluorometilo o un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno a tres átomos de halógeno) son más preferibles.

55 Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante la Fórmula (1), son preferibles aquellos en los que X es un átomo de oxígeno.

Son más preferibles los compuestos de Fórmula (1) en la que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} o un grupo ciano, R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4} ; un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C_{1-6} , fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos, y R^{11} es un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , y un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno a tres sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , nitro, haloalquilo de C_{1-4} , y haloalcoxi de C_{1-4}); o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y X es un átomo de oxígeno.

Entre los compuestos preferibles, son particularmente preferibles aquellos en los que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} , R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-6} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno, o grupos alquilo de C_{1-4}), un grupo piridilo (opcionalmente sustituido en el anillo piridínico con uno o más grupos alquilo de C_{1-4}); o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C_{1-6} , fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y 1,3-dioxolan-2-ilo; R^{11} es un grupo trifluorometilo o un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno a tres átomos de halógeno); y X es un átomo de oxígeno.

Entre el compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1), son preferibles los representados mediante las Fórmulas (1a), (1b), y (1f), y son más preferibles los representados mediante las Fórmulas (1a) y (1f).



en las que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , X, Y, m, y n son como se definen anteriormente.

Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante las Fórmulas (1a) y (1f), son preferibles aquellos en los que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} o un grupo ciano, y son más preferibles aquellos en los que R^1 es un grupo haloalquilo de C_{1-4} . De manera específica, son particularmente preferibles los compuestos en los que R^1 es un grupo trifluorometilo.

Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante las Fórmulas (1a) y (1f), son preferibles aquellos en los que R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4} ; un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4}); o un grupo alquilo de C_{1-4} sustituido con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C_{1-6} , fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos. Son más preferibles aquellos en los que R^{10} es un grupo alquilo de C_{1-6} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno, o grupos alquilo de C_{1-4}); un grupo

piridilo (opcionalmente sustituido en el anillo piridínico con uno o más, y preferentemente uno o dos grupos alquilo de C₁₋₄); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y 1,3-dioxolan-2-ilo. Son particularmente preferibles los compuestos en los que R¹⁰ es un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo piridilo, un grupo 2,2-dimetoxietilo, o un grupo (1,3-dioxolan-2-ilo)metilo.

Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante las Fórmulas (1a) y (1f), son preferibles aquellos en los que R¹¹ es un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, y un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente 1 ó 3 sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, nitro, haloalquilo de C₁₋₄, y haloalcoxi de C₁₋₄); o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno). Los compuestos en los que R¹¹ es un grupo trifluorometilo o un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno a tres átomos de halógeno) son más preferibles.

Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante las Fórmulas (1a) y (1f), son preferibles aquellos en los que X es un átomo de oxígeno.

Más preferibles son los compuestos de Fórmulas (1a) y (1f) en las que R¹ es un grupo haloalquilo de C₁₋₄ o un grupo ciano, R¹⁰ es un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alquilo de C₁₋₄ y haloalquilo de C₁₋₄); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos, R¹¹ es un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno a tres sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, nitro, haloalquilo de C₁₋₄, y haloalcoxi de C₁₋₄); o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y X es un átomo de oxígeno.

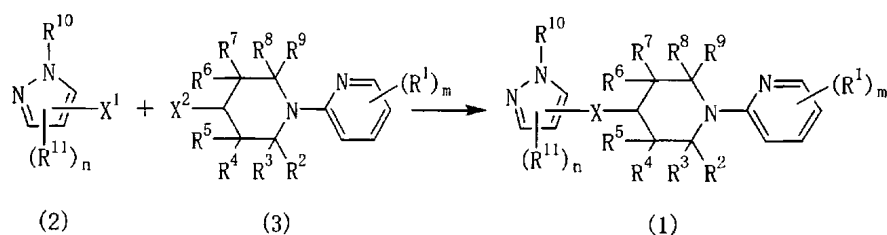
Entre los compuestos preferibles, son particularmente preferibles aquellos en los que R¹ es un grupo haloalquilo de C₁₋₄, R¹⁰ es un grupo alquilo de C₁₋₆; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno, o grupos alquilo de C₁₋₄); un grupo piridilo (opcionalmente sustituido en el anillo piridínico con uno o más, y preferentemente uno o dos grupos alquilo de C₁₋₄); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más, y preferentemente uno o dos sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más, y preferentemente uno o dos átomos de halógeno), y 1,3-dioxolan-2-ilo, R¹¹ es un grupo trifluorometilo o un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno a tres átomos de halógeno), y X es un átomo de oxígeno.

Entre los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados mediante la Fórmula (1a), son preferibles aquellos en los que uno cualquiera de R⁴, R⁵, R⁶, y R⁷ es un grupo alquilo de C₁₋₄ que está situado en trans con respecto al X en la posición 4 del anillo piperidínico. Son particularmente preferibles los compuestos en los que el grupo alquilo de C₁₋₄ es un grupo metilo.

Método para producir el compuesto de N-piridilpiperidina

El compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1) se puede producir, por ejemplo, mediante uno cualquiera de los métodos mostrados en los Esquemas de Reacción 1 a 5 a continuación.

Esquema de Reacción 1



en el que $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, X^1, X^2, m,$ y n son como se definen anteriormente.

5 En el método mostrado en el Esquema de Reacción 1, se hace reaccionar un compuesto pirazólico de Fórmula (2) y un compuesto piperidínico de Fórmula (3) en un disolvente en presencia de una base, para producir un compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1).

10 El disolvente usado en la reacción del compuesto de Fórmula (2) y del compuesto de Fórmula (3) puede ser uno cualquiera de una amplia variedad de disolventes conocidos que son inertes a esta reacción. Los ejemplos de tales disolventes incluyen hidrocarburos alifáticos o alicíclicos tales como hexano, ciclohexano, y heptano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, clorobenceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, 1,2-dicloroetano, cloroformo, y tetracloruro de carbono; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, y 1,4-dioxano; ésteres tales como acetato de metilo y acetato de etilo; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; amidas tales como N,N-dimetilformamida; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; disolventes polares apróticos tales como dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona, y N,N'-dimetilimidazolinona; y similares. Tales disolventes se pueden usar solos o como una mezcla de dos o más.

20 El disolvente se usa habitualmente en una cantidad de 1 a 500 partes en peso, y preferentemente 5 a 100 partes en peso, por parte en peso del compuesto piperidínico de Fórmula (3).

25 La base usada para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3) puede ser cualquier base inorgánica u orgánica. Ejemplos de la base inorgánica incluyen metales alcalinos tales como sodio y potasio; carbonatos de metales alcalinos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, y bicarbonato de sodio; hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; y similares. Los ejemplos de tales bases orgánicas incluyen alcóxidos de metales alcalinos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, y terc-butóxido de potasio; aminas tales como trietilamina, diisopropilamina, y piridina; y similares. Tales bases se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

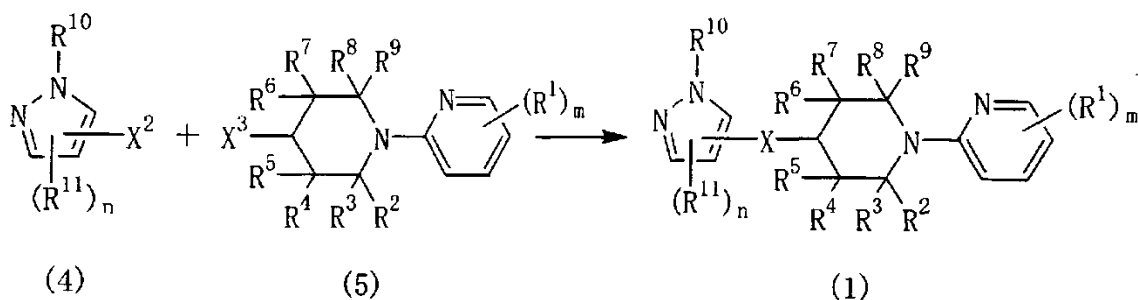
30 La base se usa habitualmente en una cantidad de 0,1 a 100 equivalentes, preferentemente 0,5 a 5 equivalentes, y más preferentemente 1 a 1,5 equivalentes, por equivalente del compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (3).

35 La relación del compuesto pirazólico representado mediante la Fórmula (2) al compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (3) puede ser seleccionada adecuadamente de un amplio intervalo. El compuesto pirazólico de Fórmula (2) se usa preferentemente en una cantidad de al menos 0,5 moles, y más preferentemente 0,8 a 1,5 moles, por mol del compuesto piperidínico de Fórmula (3).

40 La reacción se puede llevar a cabo habitualmente a una temperatura en el intervalo de -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente usado. La temperatura de reacción es preferentemente 0°C hasta la temperatura del punto de ebullición del disolvente usado. La reacción se lleva a cabo más preferentemente mientras se calienta a reflujo.

45 El tiempo de reacción varía dependiendo de la temperatura de reacción, etc., y de este modo no se puede especificar completamente. Sin embargo, la reacción está terminada habitualmente en alrededor de 0,5 a alrededor de 24 horas.

Esquema de Reacción 2



50 (en el que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, X^2, X^3, m$ y n son como se definen anteriormente).

55 En el método mostrado en el Esquema de Reacción 2, un compuesto pirazólico de Fórmula (4) y un compuesto piperidínico de Fórmula (5) se hacen reaccionar en presencia de una base en un disolvente, para producir un compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1).

El disolvente usado para la reacción del compuesto de Fórmula (4) y el compuesto de Fórmula (5) puede ser uno cualquiera de una amplia variedad de disolventes conocidos que son inertes para esta reacción. Por ejemplo, se puede usar cualquier disolvente que se puede usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales disolventes se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

5 El disolvente se usa habitualmente en una cantidad de alrededor de 1 a alrededor de 500 partes en peso, y preferentemente alrededor de 5 a alrededor de 100 partes en peso, por parte en peso del compuesto piperidínico de Fórmula (5).

10 La base usada para la reacción del compuesto de Fórmula (4) y el compuesto de Fórmula (5) puede ser cualquier base inorgánica u orgánica conocida. Por ejemplo, se puede usar cualquier base que se puede usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales bases se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

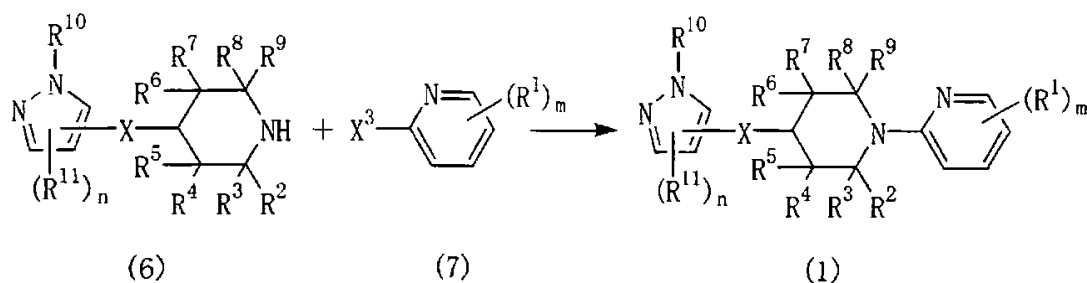
15 La base se usa habitualmente en una cantidad de 0,1 a 100 equivalentes, preferentemente 0,5 a 5 equivalentes, y más preferentemente 1 a 1,5 equivalentes, con relación al compuesto piperidínico de Fórmula (5).

20 La proporción del compuesto pirazólico de Fórmula (4) al compuesto piperidínico de Fórmula (5) se puede seleccionar adecuadamente de un amplio intervalo. El compuesto pirazólico de Fórmula (4) se usa preferentemente en una cantidad de al menos 0,5 moles, y más preferentemente 0,8 a 1,5 moles, por mol del compuesto piperidínico de Fórmula (5).

25 La reacción se puede llevar a cabo a una temperatura en el intervalo desde -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente usado. La temperatura de reacción es preferentemente 0°C a la temperatura del punto de ebullición del disolvente usado. La reacción se lleva a cabo más preferentemente mientras se caliente a reflujo.

El tiempo de reacción varía dependiendo de la temperatura de reacción, etc., y de este modo no puede especificarse completamente. La reacción está terminada habitualmente en alrededor de 0,5 a alrededor de 24 horas.

30 Esquema de Reacción 3



en el que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, X^3, m,$ y n son como se definen anteriormente.

35 En el método mostrado en Esquema de Reacción 3, un compuesto piperidínico de Fórmula (6) y un compuesto piridínico de Fórmula (7) se hacen reaccionar en un disolvente en presencia de una base, para producir un compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1).

40 El disolvente usado para la reacción del compuesto de Fórmula (6) y el compuesto de Fórmula (7) puede ser uno cualquiera de una amplia variedad de disolventes conocidos que son inertes para esta reacción. Por ejemplo, se puede usar cualquier disolvente que se puede usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales disolventes se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

45 La cantidad de disolvente es habitualmente 1 a 500 partes en peso, y preferentemente 5 a 100 partes en peso, por parte en peso del compuesto piperidínico de Fórmula (6).

50 La base usada en la reacción del compuesto de Fórmula (6) y el compuesto de Fórmula (7) puede ser cualquier base inorgánica u orgánica conocida. Por ejemplo, se puede usar cualquier disolvente que se puede usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales disolventes se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

La base se usa habitualmente en una cantidad de 0,1 a 100 equivalentes, preferentemente 0,5 a 5 equivalentes, y más preferentemente 1 a 1,5 equivalentes, por equivalente del compuesto piperidínico de Fórmula (6).

55 La relación del compuesto pirazólico de Fórmula (6) al compuesto piperidínico de Fórmula (7) se puede seleccionar

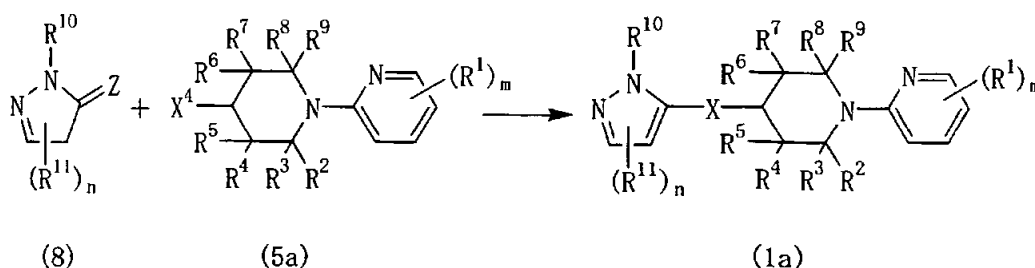
adecuadamente de un amplio intervalo. El compuesto piperidínico de Fórmula (7) se usa preferentemente en una cantidad de al menos 0,5 moles, y más preferentemente 0,8 a 1,5 moles, por mol del compuesto pirazólico de Fórmula (6).

5 La reacción se puede llevar a cabo habitualmente a una temperatura en el intervalo de -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente usado. La temperatura de reacción es preferentemente 0°C a la temperatura del punto de ebullición del disolvente usado. La reacción se lleva a cabo más preferentemente mientras se calienta a reflujo.

10 El tiempo de reacción varía dependiendo de la temperatura de reacción, etc. y de este modo no se puede especificar completamente. La reacción está terminada habitualmente en alrededor de 0,5 a alrededor de 24 horas.

El compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1a) también se puede producir mediante el método mostrado en el Esquema de Reacción 4 a continuación.

15 Esquema de Reacción 4



20 en el que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, X^1, X^2, X^3, m$ y n son como se definen anteriormente, Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, X^4 es X^2 o X^3 , y X^2 y X^3 son como se definen anteriormente.

25 En el método mostrado en el Esquema de Reacción 4, un compuesto pirazolónico de Fórmula (8) y un compuesto piperidínico de Fórmula (5a) se hacen reaccionar en un disolvente en presencia de una base, para producir un compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1a).

El compuesto piperidínico de Fórmula (5a) es un compuesto representado mediante la Fórmula (3) o un compuesto representado mediante la Fórmula (5).

30 El disolvente usado para la reacción del compuesto de Fórmula (8) y el compuesto de Fórmula (5a) puede ser uno cualquiera de una amplia variedad de disolventes conocidos que son inertes para esta reacción. Por ejemplo, se puede usar cualquier disolvente que se puede usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales disolventes se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

35 El disolvente se usa habitualmente en una cantidad de 1 a 500 partes en peso, y preferentemente 5 a 100 partes en peso, por parte en peso del compuesto piperidínico de Fórmula (5a).

40 La base usada para la reacción del compuesto de Fórmula (8) y el compuesto de Fórmula (5a) puede ser cualquier base inorgánica u orgánica conocida. Por ejemplo, se pueden usar todos disolventes que se pueden usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales disolventes se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

La base se usa habitualmente en una cantidad de 0,1 a 100 equivalentes, preferentemente 0,5 a 5 equivalentes, y más preferentemente 1 a 1,5 equivalentes, por equivalente del compuesto piperidínico de Fórmula (5a).

45 La relación del compuesto pirazolónico representado mediante la Fórmula (8) al compuesto piperidínico de Fórmula (5a) se puede seleccionar adecuadamente de un amplio intervalo. El compuesto pirazolónico de Fórmula (8) se usa preferentemente en una cantidad de 0,5 moles o más, y más preferentemente 0,8 a 1,5 moles, por mol del compuesto piperidínico de Fórmula (5a).

50 La reacción se puede llevar a cabo habitualmente a una temperatura en el intervalo de -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente usado. La temperatura de la reacción es preferentemente 0°C a la temperatura del punto de ebullición del disolvente usado. La reacción se lleva a cabo más preferentemente mientras se calienta a reflujo.

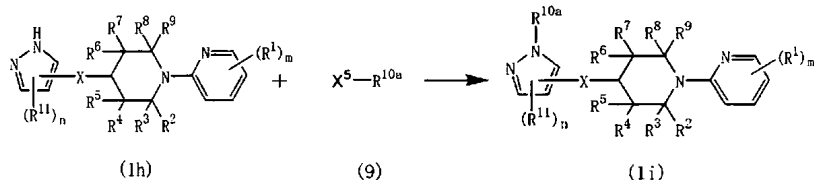
55 El tiempo de reacción varía dependiendo de la temperatura de reacción, etc., y de este modo no se puede especificar completamente. La reacción está terminada habitualmente en alrededor de 0,5 a alrededor de 24 horas.

Entre los compuestos de N-piridilpiperidina representados mediante la Fórmula (1), el Compuesto (1i), en el que R^{10}

es R^{10a} , se puede producir mediante el método mostrado en el Esquema de Reacción 5 a continuación, usando el Compuesto (1h) correspondiente, en el que R^{10} es un átomo de hidrógeno.

Esquema de Reacción 5

5



en el que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10a}, R^{11}, X, X^5, m$ y n son como se definen anteriormente.

10 En el Esquema de Reacción 5, un compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h) se sustituye en la posición 1 del anillo pirazólico con n compuesto de Fórmula (9) en un disolvente en presencia de una base, para producir un compuesto de N-piridilpiperidina representado mediante la Fórmula (1i).

15 El disolvente usado para la reacción del compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h) y el compuesto de Fórmula (9) puede ser uno cualquiera de una amplia variedad de disolventes conocidos que son inertes para esta reacción. Por ejemplo, se puede usar cualquier disolvente que se puede usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales disolventes se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

20 El disolvente se usa habitualmente en una cantidad de alrededor de 1 a alrededor de 500 partes en peso, y preferentemente alrededor de 5 hasta alrededor de 100 partes en peso, por parte en peso del compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h).

25 La base usada para la reacción del compuesto de Fórmula (1h) y el compuesto de Fórmula (9) puede ser cualquier base inorgánica u orgánica conocida. Por ejemplo, se pueden usar todas las bases que se pueden usar para la reacción del compuesto de Fórmula (2) y el compuesto de Fórmula (3). Tales bases se pueden usar individualmente o como una mezcla de dos o más.

30 La base se usa habitualmente en una cantidad de 0,1 a 100 equivalentes, preferentemente 0,5 a 5 equivalentes, y más preferentemente 1 a 1,5 equivalentes, por equivalente del compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h).

35 La proporción del compuesto de Fórmula (9) al compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h) se puede seleccionar adecuadamente de un amplio intervalo. El compuesto pirazólico de Fórmula (9) se usa preferentemente en una cantidad de 0,5 moles o más, y más preferentemente 0,8 a 1,5 moles, por mol del compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h).

40 La reacción se puede llevar a cabo habitualmente a una temperatura en el intervalo de -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente usado. La temperatura de reacción es preferentemente 0°C a la temperatura del punto de ebullición del disolvente usado. La reacción se lleva a cabo más preferentemente mientras se calienta a reflujo.

El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, etc., y, de este modo no se puede especificar completamente. La reacción está terminada habitualmente en alrededor de 0,5 hasta alrededor de 24 horas.

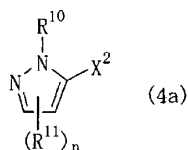
45 En la reacción, el compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1h) puede existir como tautómeros que tienen diferentes disposiciones en el anillo pirazólico. Por ejemplo, se puede formar un compuesto N-piridilpiperidínico de Fórmula (1a) y un compuesto N-piridilpiperidínico de Fórmula (1b) que son isómeros entre ellos. Estos isómeros se pueden aislar fácilmente por medios de purificación, tales como cromatografía en columna.

50 En el Esquema de Reacción 5, el compuesto piperidínico usado como material de partida de Fórmula (1h) se puede producir mediante uno cualquiera de los métodos descritos en los Esquemas de Reacción 1 a 4. El compuesto de Fórmula (9) a usar puede ser un producto comercialmente disponible, o se puede producir fácilmente mediante un método conocido.

55 En los Esquemas de Reacción 1, 2, y 4 anteriores, todos los compuestos pirazólicos de Fórmulas (2) y (4) y el compuesto pirazolónico de Fórmula (8) usados como materiales de partida son compuestos conocidos que están fácilmente disponibles, o se pueden producir fácilmente según métodos conocidos, tales como los métodos descritos en "Dai-yukikagaku, vol. 15, Heterocyclic Compounds II", 6ª Edición, 1965, páginas 258 a 317, y "The Chemistry of Heterocyclic Compounds Vol. 20. Pirazolones, Pirazolidones y Derivativos", Richard H. Wiley y Paul Wiley, Interscience Publishers, Londres UK, 1964.

60

Un compuesto pirazolónico de Fórmula (8) y un compuesto pirazólico representado mediante la Fórmula (4a) a continuación pueden existir como tautómeros ceto-enólicos.

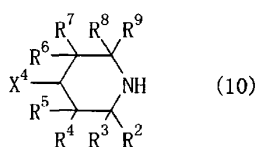


5

en la que R^{10} , R^{11} , X^2 , y n son como se definen anteriormente.

10

El compuesto piperidínico de Fórmula (3) y el compuesto piperidínico de Fórmula (5) son compuestos conocidos, o se pueden producir fácilmente mediante métodos conocidos. El compuesto piperidínico de Fórmula (3) y el compuesto piperidínico de Fórmula (5) se pueden producir, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto piridínico de Fórmula (7) con el compuesto piperidínico de Fórmula (10)



15

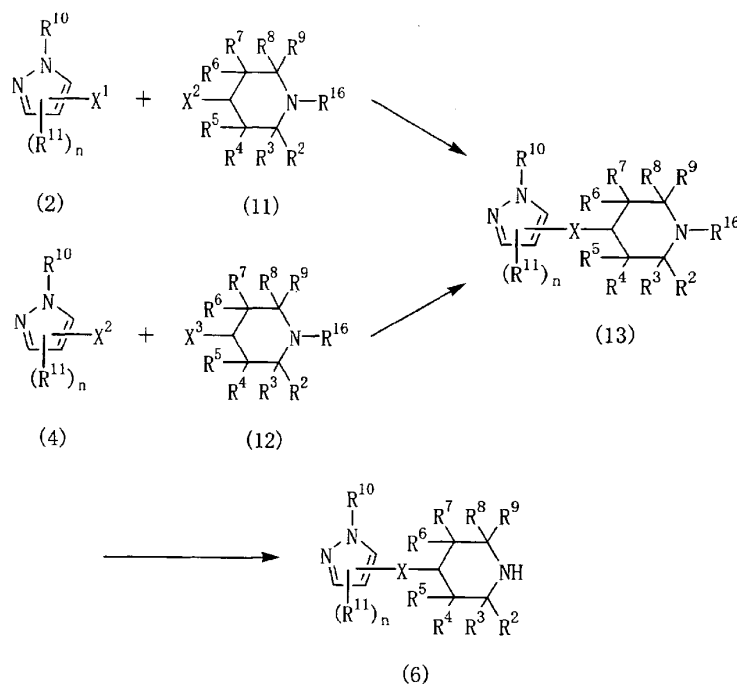
en la que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , y X^4 pueden ser como se definen anteriormente. Esta reacción se puede llevar a cabo, por ejemplo, según el método descrito en Synthesis, 606 (1981), J. Chem. Soc., C., 3693 (1971).

20

El compuesto piperidínico de Fórmula (10) y el compuesto piridínico representado mediante la Fórmula (7) son compuestos conocidos, o se pueden producir fácilmente mediante métodos conocidos.

El compuesto piperidínico de Fórmula (6) se puede producir fácilmente, por ejemplo, mediante el método mostrado en el Esquema de Reacción 6.

25 Esquema de Reacción 6



30

(en el que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , X , X^1 , X^2 , X^3 , y n son como se definen anteriormente, y R^{16} es un grupo metilo o un grupo bencilo).

Según el método mostrado en el Esquema de Reacción 5, un compuesto pirazólico de Fórmula (2) y un compuesto piperidínico de Fórmula (11), o un compuesto pirazólico de Fórmula (4) y un compuesto piperidínico de Fórmula (12)

se hacen reaccionar para producir un compuesto piperidínico de Fórmula (13). Posteriormente, el sustituyente R¹⁶ se elimina del esqueleto piperidínico del compuesto piperidínico de Fórmula (13) para producir un compuesto piperidínico de Fórmula (6).

5 Los compuestos piperidínicos de Fórmulas (11) y (12) son compuestos conocidos, o se pueden producir fácilmente mediante métodos conocidos.

10 La reacción del compuesto pirazólico de Fórmula (2) y el compuesto piperidínico de Fórmula (11) se puede llevar a cabo en las mismas condiciones de reacción que la reacción de los compuestos de Fórmulas (2) y (3) mostrada en el Esquema de Reacción 1.

15 La reacción del compuesto pirazólico de Fórmula (4) y el compuesto piperidínico de Fórmula (12) se puede llevar a cabo en las mismas condiciones de reacción que la reacción de los compuestos de Fórmulas (4) y (5) mostrada en el Esquema de Reacción 2.

La reacción para eliminar el sustituyente R¹⁶ del esqueleto piperidínico del compuesto piperidínico de Fórmula (13) se puede llevar a cabo en condiciones de desmetilación o desbencilación conocidas, tales como las condiciones de reacción descritas en los documentos WO 2005/095380, WO 96/37484, patente U.S. n° 5569664, etc.

20 Los compuestos obtenidos en las reacciones anteriores se pueden aislar fácilmente por medios de aislamiento habituales, tales como extracción con disolventes orgánicos, cromatografía, recristalización, destilación, y métodos similares, y se pueden purificar además por medios de purificación habituales.

25 El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) se puede usar para el control de plagas agrícolas, y preferentemente se pueden usar para el control de plagas de insectos y de ácaros, tales como *Lepidoptera*, *Hemiptera*, *Thysanoptera*, y *Coleoptera*.

30 El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado mediante la Fórmula (1) presenta excelentes efectos de control de plagas, incluso cuando se usa en una pequeña cantidad. Los ejemplos de ácaros incluyen ácaros parasitarios de plantas en diversos campos de la agricultura y horticultura. Sus efectos específicos incluyen ácaros araña tales como *Tetranychus urticae* (ácaro de dos puntos), *Panonychus citri* (ácaro rojo de cítricos), *Tetranychus kanzawai* (ácaro araña de Kanazawa), y *Panonychus ulmi* (ácaro rojo europeo); ácaros enroñadores tales como *Aculops pelekassi* (ácaro enroñador de cítricos rosa), *Phyllocoptruta citri Soliman et Abou-Awad*, *Aculops lycopersici* (vaates), y *Eriophyes chibaensis* (ácaro tostado del peral japonés); ácaros del olivo tales como *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco) y *Phytonemus pallidus* (ácaro del ciclamen); ácaros de la harina tales como *Tyrophagus putrescentiae* (ácaro del moho), y *Rhizoglyphus robini* (ácaro de los bulbos).

Acaricida

40 Los acaricidas se describen más abajo como ejemplos de los agentes de control de plagas de la invención.

45 El compuesto de N-piridilpiperidina de la invención representado por la Fórmula (1) se puede usar como un acaricida sin añadir ningún otro ingrediente. El compuesto de N-piridilpiperidina se mezcla habitualmente con diversos vehículos en forma de sólidos, líquidos, o gases, opcionalmente se guía de la adición de tensioactivos y/u otros materiales auxiliares para la preparación de formulaciones, y después se formula en diversas formas, tales como disoluciones oleosas, concentrados emulsionables, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, concentrados en suspensión, polvos solubles en agua, gránulos, gránulos finos, polvos finos, pulverizaciones, aerosoles, microcápsulas, fumigantes y similares.

50 El compuesto de N-piridilpiperidina de Fórmula (1) se puede incorporar en tales formulaciones en una cantidad adecuada que se puede seleccionar de un amplio intervalo según diversas condiciones, tal es como el tipo de formulación, lugar de aplicación, etc. Tales formulaciones contienen habitualmente el compuesto de N-piridilpiperidina en una cantidad de alrededor de 0,01 a alrededor de 95% en peso, y preferentemente alrededor de 0,1 a alrededor de 50% en peso.

55 Los ejemplos de vehículos sólidos usados para la preparación de tales formulaciones incluyen arcillas tales como arcilla de caolín, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla de Fubasami, y arcilla ácida; talcos; minerales inorgánicos tales como materiales cerámicos, celita, cuarzo, azufre, carbón activado, carbonato de silicio y sílice hidratada; polvos finos y gránulos tales como fertilizantes químicos; y similares.

60 Los ejemplos de vehículos líquidos incluyen agua; alcoholes tales como metanol y etanol; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos alifáticos y alicíclicos tales como n-hexano, ciclohexano, queroseno, y aceite ligero; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, y naftaleno; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como aceto nitrilo e isobutironitrilo; éteres tales como éter diisopropílico y dioxano; amidas de ácidos, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona, y N,N'-dimetilimidazolinona; hidrocarburos halogenados tales como clorometano, tricloroetano y tetracloruro de carbono;

65

dimetilsulfóxido; aceites vegetales tales como aceite de haba de soja, y aceite de semilla de algodón; y similares.

Los ejemplos de vehículos gaseosos incluyen aquellos usados generalmente en propelentes, tal como gas butano, LPG (gas de petróleo licuado), éter dimetílico, y dióxido de carbono.

Lo ejemplos del tensoactivo incluyen tensoactivos no iónicos y tensoactivos aniónicos.

Los ejemplos específicos de tensoactivos no iónicos incluyen tensoactivos no iónicos de ésteres de azúcares tales como ésteres de ácido graso con sorbitán, y ésteres de ácido graso con polioxietilensorbitán; tensoactivos no iónicos de ésteres de ácidos grasos tales como ésteres de ácidos grasos polioxietilénicos; tensoactivos no iónicos de aceites vegetales tales como aceite de ricino polioxietilénado; tensoactivos no iónicos de alcoholes tales como polioxietilenaquil éter; tensoactivos no iónicos de alquilefenoles tales como condensado de formalina con polioxietilenaquil (C₈₋₁₂) fenil éter; tensoactivos no iónicos de polímeros de bloques de polioxietileno-polioxipropileno tales como polímeros de bloques de polioxietileno-polioxipropileno; tensoactivos no iónicos aromáticos tales como fenil fenil éter; y similares.

Los ejemplos específicos de tensoactivos aniónicos incluyen tensoactivos aniónicos de sulfonatos tales como alquilbencenosulfonato, alquilsulfosuccinato, y alilsulfonato; tensoactivos aniónicos de sulfatos tales como alquilsulfato, y polioxietilenaquilsulfato; lignosulfito; y similares.

Los ejemplos de materiales auxiliares para la preparación de formulaciones incluyen agentes de fijación, agentes dispersantes, espesantes, conservantes, agentes anticongelantes, estabilizantes, adyuvantes, y similares.

Los ejemplos de agentes de fijación y agentes dispersantes incluyen caseína, gelatina, polisacáridos (por ejemplo, almidón, goma arábiga, derivados de celulosa, ácido algínico), derivados de lignina, bentonina, azúcares, polímeros sintéticos solubles en agua (por ejemplo, polialcohol vinílico, polivinilpirrolidona, poliácidos acrílicos), y similares.

Los ejemplos de espesantes incluyen compuestos poliméricos solubles en agua, tal como goma de xantana, carboximetilcelulosa, bentonita de pureza elevada, carbón blanco, y similares.

Los ejemplos de conservantes incluyen benzoato de sodio, éster de ácido p-hidroxibenzoico, y similares.

Los ejemplos de agentes anticongelantes incluyen etilenglicol, dietilenglicol, y similares.

Los ejemplos de estabilizantes incluyen PAP (fosfato ácido de isopropilo), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol), BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol), aceites vegetales, aceites minerales, tensoactivos, ácidos grasos y sus ésteres, y similares.

Los ejemplos de adyuvantes incluyen aceite de haba de soja, aceite de maíz, y aceites vegetales similares, aceite de máquinas, glicerol, polietilenglicol y similares.

Tales preparaciones farmacéuticas se pueden colorear con un colorante orgánico o inorgánico.

El compuesto de la invención se puede mezclar con otros agentes tales como insecticidas, nematocidas, acaricidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, sinérgicos (por ejemplo butóxido de piperonilo), o acondicionadores del suelo, y se pueden formular previamente como una mezcla. Como alternativa, el acaricida de la invención y esos otros agentes se pueden usar juntos sin mezclarlos previamente.

El compuesto de la invención se puede usar como un acaricida agrícola en cualquier cantidad adecuada que se puede seleccionar apropiadamente de un amplio intervalo según diversas condiciones, tal como el tipo de formulación, el método de aplicación, el tiempo de aplicación, el lugar de aplicación, el tipo de cosecha a proteger, y el tipo de ácaro a controlar. El compuesto se usa habitualmente en una cantidad de alrededor de 0,1 a alrededor de 1.000 g, y preferentemente alrededor de 10 a alrededor de 500 g, por 100 m² del área. Cuando el compuesto de la invención en forma de un concentrado emulsionable, polvo humectable, concentrado en emulsión, o similar, se diluye con agua, el compuesto se usa habitualmente en una concentración de 1 a alrededor de 1.000 ppm, y preferentemente alrededor de 10 a alrededor de 500 ppm. Los gránulos, polvos finos, y formulaciones similares se pueden usar como tales sin diluirlos.

EFFECTO DE LA INVENCION

Los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados por la Fórmula (1), sus N-óxidos, o sales de estos compuestos, tienen actividad de control de plagas, tales como actividad acaricida elevada frente a ácaros enroñadores así como frente a ácaros araña.

Por lo tanto, los compuestos de N-piridilpiperidina de la invención representados por la Fórmula (1), sus N-óxidos, o sales de estos compuestos, se usan adecuadamente como agentes de control de plagas, y particularmente

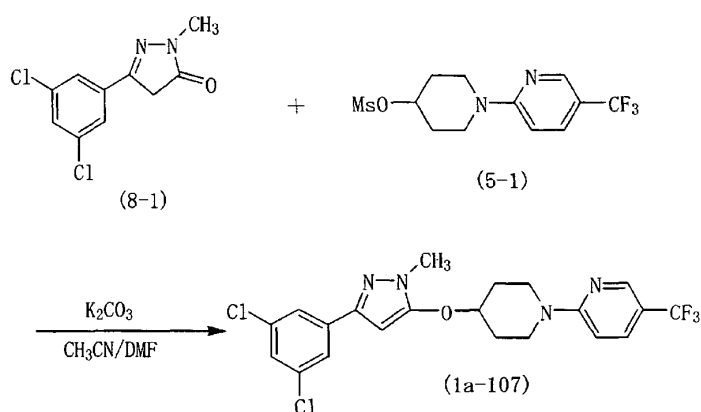
preferible para uso como acaricidas.

Mejor modo para llevar a cabo la invención

5 La presente invención se describe con más detalle con referencia a los Ejemplos de Producción, Ejemplos de Formulación, y Ejemplos de Ensayo de los compuestos de la invención. Sin embargo, la invención no está limitada a ellos o por ellos.

Ejemplo 1 de producción

10 Producción de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-1-metilpirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº: 1a-107)

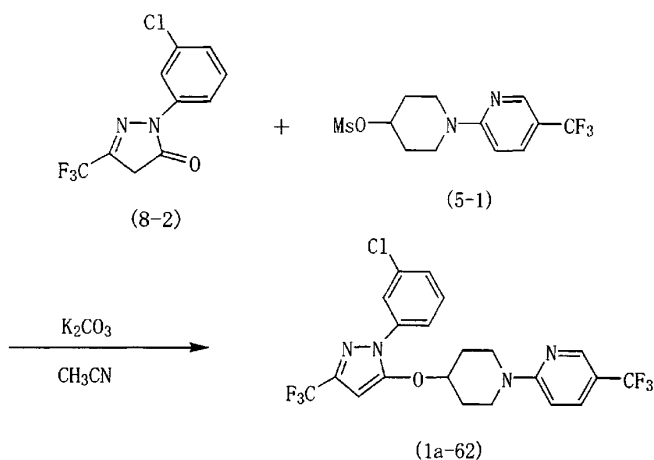


15 (en el que MsO es un grupo metanosulfonilo).

20 0,58 g de 3-(3,5-diclorofenil)-1-metilpirazolin-5-ona (8-1), 0,70 g de metanosulfonato de 1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-4-ilo (5-1), y 0,45 g de carbonato de potasio se suspendieron en una mezcla de 50 ml de acetonitrilo y 20 ml de N,N-dimetilformamida (DMF). La mezcla resultante se calentó a reflujo toda la noche, se enfrió hasta la temperatura ambiente, y después se filtró a través de celita. Después de que se añadió disolución salina al filtrado, la mezcla se extrajo con éter dietílico. La capa orgánica se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 → 4:1) para producir 0,64 g de Compuesto (1a-107).

Ejemplo 2 de producción

30 Producción de 4-[1-(3-clorofenil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-62)



(en el que MsO es como se define anteriormente).

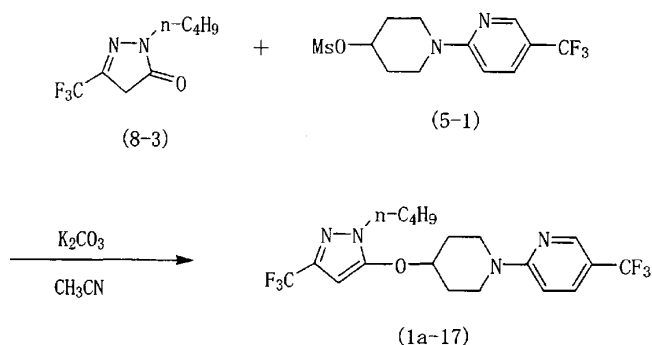
35 0,50 g de 1-(3-clorofenil)-3-(trifluorometil)pirazolin-5-ona (8-2), 0,62 g de compuesto (5-1), y 0,52 g de carbonato de potasio se suspendieron en 20 ml de acetonitrilo. La mezcla resultante se calentó a reflujo toda la noche, se enfrió

hasta la temperatura ambiente, y después se filtró a través de celita. El filtrado se concentró a presión reducida. Después de que se añadió agua al residuo, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 → 4:1) para producir 0,20 g de Compuesto (1a-62).

5

Ejemplo 3 de producción

Producción de 4-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-17)



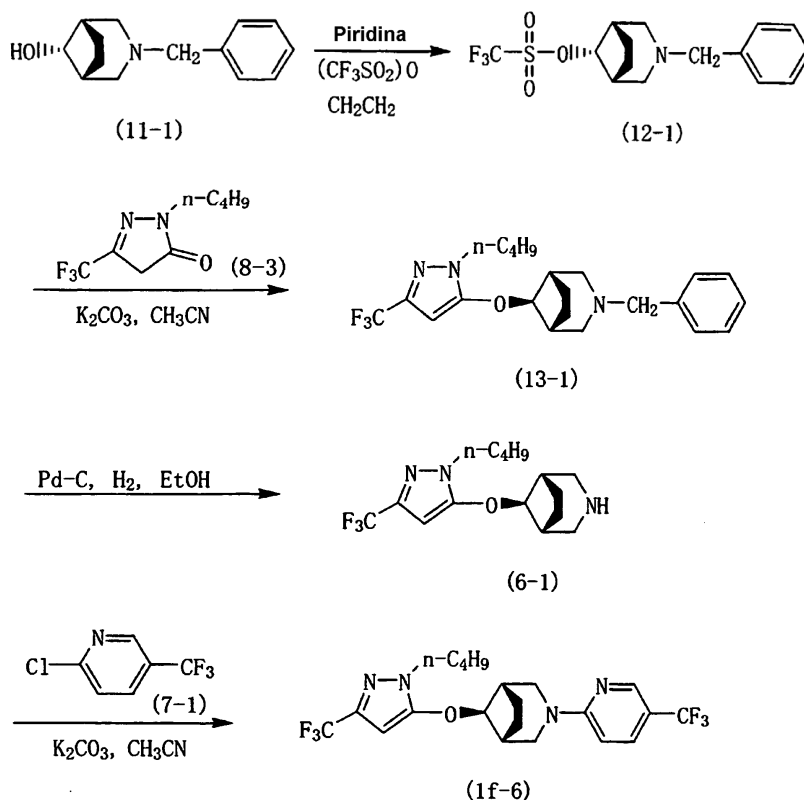
10

(en el que MsO es como se define anteriormente).

0,31 g de 1-butil-3-(trifluorometil)pirazolin-5-ona (8-3), 0,49 g de Compuesto (5-1), y 0,41 g de carbonato de potasio se suspendieron en 20 ml de acetonitrilo. La mezcla resultante se calentó a reflujo toda la noche, se enfrió hasta la temperatura ambiente, y después se filtró a través de celita. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 1:0 → 8:1) para producir 0,42 g de Compuesto (1a-17).

20 Ejemplo 4 de producción

Producción de 8 β-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1f-6)



(1) Producción de Compuesto (12-1)

El N-bencil-3-azabicyclo[3.2.1]octan-8 α -ol (10-1) se sintetizó según el método descrito en J. Med. Chem., 2003, 46, 1456-1464. Se disolvieron 5,05 g de compuesto (11-1) en 35 ml de cloruro de metileno. Mientras la disolución se agitó bajo enfriamiento con hielo, se añadieron gota a gota 10 ml de una disolución de cloruro de metileno que contiene 13,11 g de anhídrido trifluorometanosulfónico. Posteriormente, se añadieron gota a gota 10 ml de una disolución de cloruro de metileno que contiene 16,54 g de piridina, y la mezcla se agitó durante 1 hora. La mezcla de reacción se añadió a una disolución saturada de hidrogenocarbonato de sodio, y la mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 20:1) para producir 8,29 g de trifluorometanosulfonato de N-bencil-3-azabicyclo[3.2.1]octan-8 α -ilo (12-1).

(2) Producción de Compuesto (13-1)

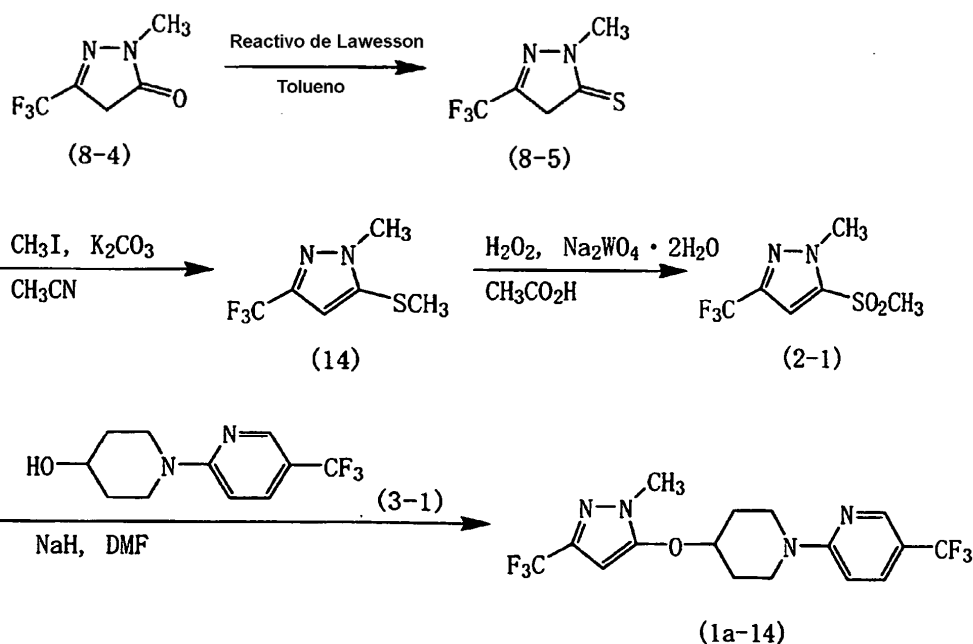
0,89 g de Compuesto (8-3), una cantidad catalítica de 18-corona-6, y 2,76 g de carbonato de potasio se suspendieron en 20 ml de DMF. La suspensión se agitó a la temperatura ambiente durante 10 minutos. Se le añadieron gota a gota 15 ml de una disolución de DMF que contiene 1,00 g de compuesto (12-1), y la mezcla se agitó a 50°C durante 2 horas. La mezcla resultante se vertió en 100 ml de agua, y se extrajo tres veces con 50 ml de acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 50:1 \rightarrow 20:1) para producir 0,83 g de 1-bencil-8 β -[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (13-1).

(3) Producción de Compuesto (1f-6)

Se añadió paladio-carbón activado (Pd al 10%) (0,1 g) a una disolución de 0,80 g del Compuesto (13-1) en 50 ml de etanol. La mezcla se agitó en una atmósfera de hidrógeno a 50°C durante 15 horas para producir 8 β -[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (6-1). La disolución de la reacción se filtró a través de celita, y se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo, y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en 50 ml de DMF. Se le añadieron 1,36 g de carbonato de potasio y 0,71 g de 2-cloro-5-trifluorometilpiridina (7-1), seguido de agitación a 70°C durante 4 horas. La mezcla se vertió en 100 ml de agua, y se extrajo dos veces con 50 ml de acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1) para producir 0,10 g de Compuesto (1f-6).

Ejemplo de producción 5

Producción de 4-[1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto n° 1a-14)



(1) Producción de Compuesto (8-5)

5,25 g de 1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ona (8-4) y 10,23 g de reactivo de Lawesson se suspendieron en 300 ml de tolueno anhidro. La suspensión se calentó a reflujo durante 6 horas. La disolución de la reacción se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 2:1) para producir 4,87 g de 1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ona (8-5).

(2) Producción de compuesto (14)

3,87 g de compuesto (8-5) y 4,40 g de carbonato de potasio se suspendieron en 100 ml de acetonitrilo. La suspensión se agitó a la temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió gota a gota una disolución de 3,62 g de yoduro de metilo en 10 ml de acetonitrilo, y la mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 12 horas. La disolución de la reacción se concentró a presión reducida. Después de que se añadió agua al residuo, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida para producir 3,60 g de 1-metil-5-metil-3-(trifluorometil)pirazol (14).

(3) Producción de Compuesto (2-1)

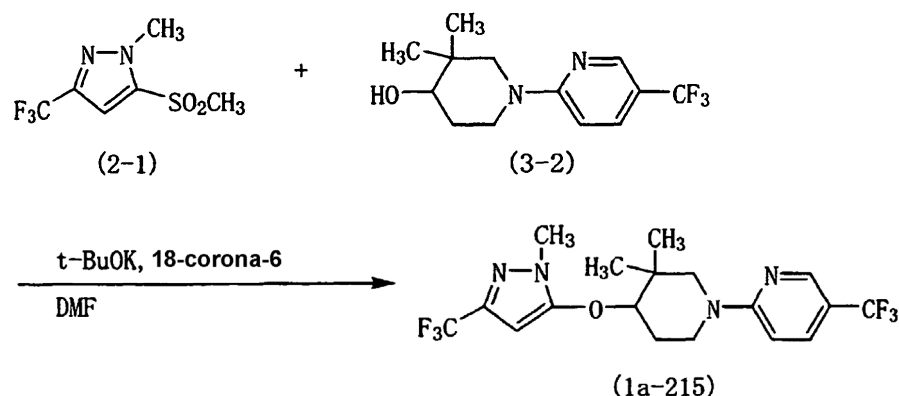
Se disolvieron 0,25 g de Compuesto (14) en 20 ml de ácido acético. Se agregaba, y se añadieron secuencialmente 0,44 g de disolución al 30% de peróxido de hidrógeno, y 0,04 g de volframato de sodio dihidratado. La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 12 horas, después se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con hidrogenocarbonato de sodio saturado, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida para producir 0,29 g de 5-metasulfonil-1-metil-3-(trifluorometil)pirazol (2-1).

(4) Producción de Compuesto (1a-14)

Se suspendieron 0,08 g de hidruro de sodio al 60% en 1 ml de DMF anhidra. Se le añadieron 5 ml de DMF anhidra que contiene 0,39 g de 1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-1-ol (3-1). La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 20 minutos. Se añadió gota a gota una disolución de 0,29 g de Compuesto (2-1) en 1 ml de DMF, y la mezcla se agitó a 100°C durante 7 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo dos veces con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1) para producir 0,20 g de 4-[1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (1a-14).

Ejemplo 6 de producción

Producción de 3,3-dimetil-4-[1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-215)

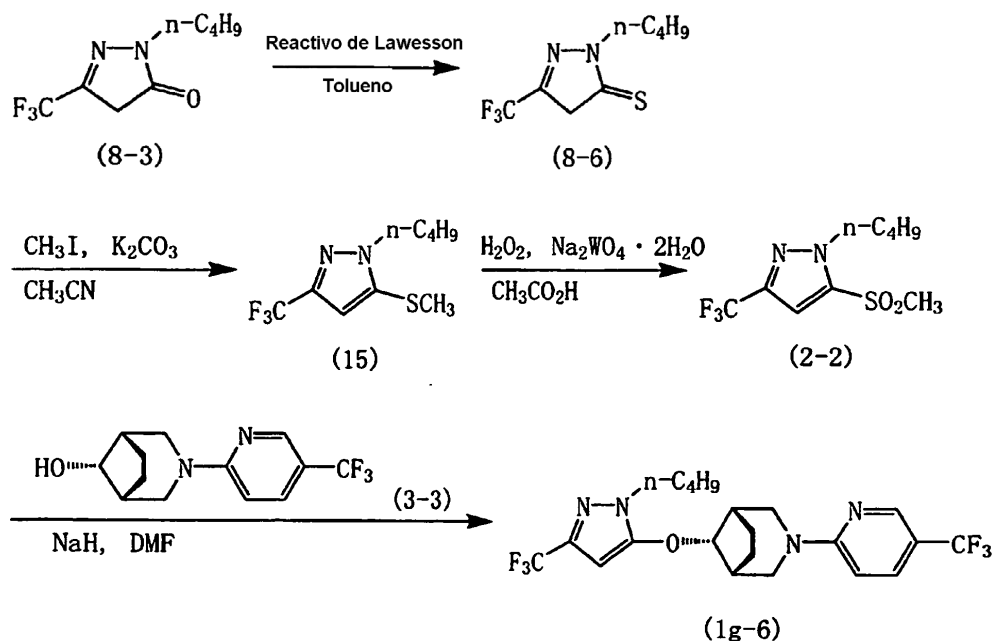


0,66 g de Compuesto (2-1), 0,80 g de 3,3-dimetil-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-1-ol (3-2), 0,65 g de t-butoxipotasio, y una cantidad catalítica de 18-crown-6 se suspendieron en 10 ml de DMF anhidra. La suspensión se agitó a 100°C durante 15 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo dos veces con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1) para producir 0,41 g de 3,3-dimetil-4-[1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (1a-215).

Ejemplo 7 de producción

Producción de 8 β -[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto n° 1f-6)

5



(1) Producción de Compuesto (8-6)

10 5,00 g de 1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ona (8-3), y 7,88 g de reactivo de Lawesson se suspendieron en 300 ml de tolueno anhidro. La suspensión se calentó a reflujo con agitación durante 6 horas. La disolución de la reacción se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 3:1) para producir 4,35 g de 1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-tiona (8-6).

15 (2) Producción de Compuesto (15)

3,35 g de compuesto (8-6) y 4,07 g de carbonato de potasio se suspendieron en 100 ml de acetonitrilo. La suspensión se agitó a la temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió gota a gota una disolución de 3,35 g de yoduro de metilo en 10 ml de acetonitrilo. La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 12 horas. La disolución de la reacción se concentró a presión reducida. Después de que se añadió agua al residuo, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida para producir 4,40 g de 1-butil-5-metiltio-3-(trifluorometil)pirazol (15).

25 (3) Producción de Compuesto (2-2)

Se disolvieron 4,40 g de Compuesto (15) en 20 ml de ácido acético. Mediante agitación, se añadieron secuencialmente 6,36 g de una disolución al 30% de peróxido de hidrógeno y 0,62 g de volfrato de sodio dihidratado. La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 4 horas, después se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con hidrogenocarbonato de sodio saturado, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida para producir 5,00 g de 1-butil-5-metanosulfonyl-3-(trifluorometil)pirazol (2-2).

35 (4) Producción de Compuesto (1g-6)

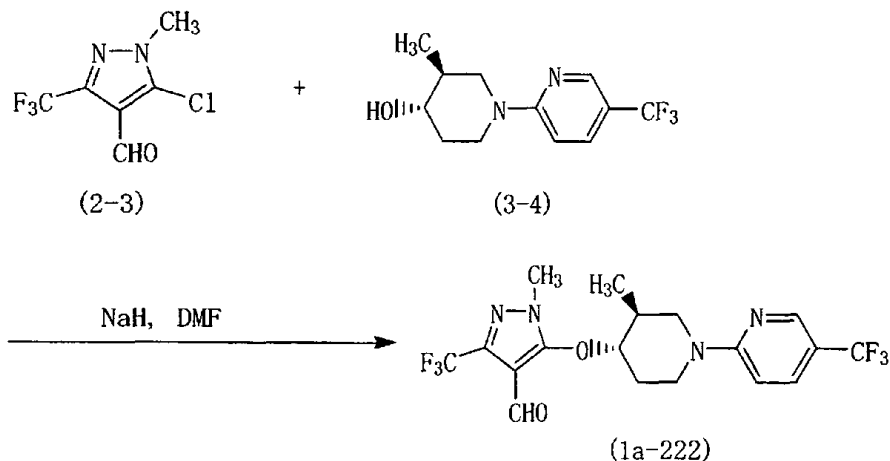
Se suspendieron 0,08 g de hidruro de sodio al 60% en 1 ml de DMF anhidra. Se añadieron a esta suspensión 5 ml de DMF anhidra que contiene 0,45 g de Compuesto (3-3). La suspensión se agitó a la temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió una disolución de 0,42 g de Compuesto (2-2) en 1 ml de DMF, y la mezcla se agitó a 100°C durante 15 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo tres veces con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 \rightarrow 1:1) para producir 0,23 g de Compuesto (1g-6).

40

Ejemplo 8 de producción

Producción de trans-3-metil-1-[4-formil-1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-222)

5



Se añadió gota a gota una disolución de 0,50 g de trans-3-metil-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-4-ol (3-4) en 5 ml de DMF anhidra a 0,08 g de hidruro de sodio al 60%. La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 30 minutos. Se le añadió una disolución de 0,41 g de 5-cloro-1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-carbaldehído (2-3) en 5 ml de DMF anhidra. La mezcla se agitó a 100°C durante 15 horas. La mezcla de reacción se vertió en 100 ml de agua, y la mezcla se extrajo dos veces con 50 ml de acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1) para producir 0,30 g de Compuesto (1a-222).

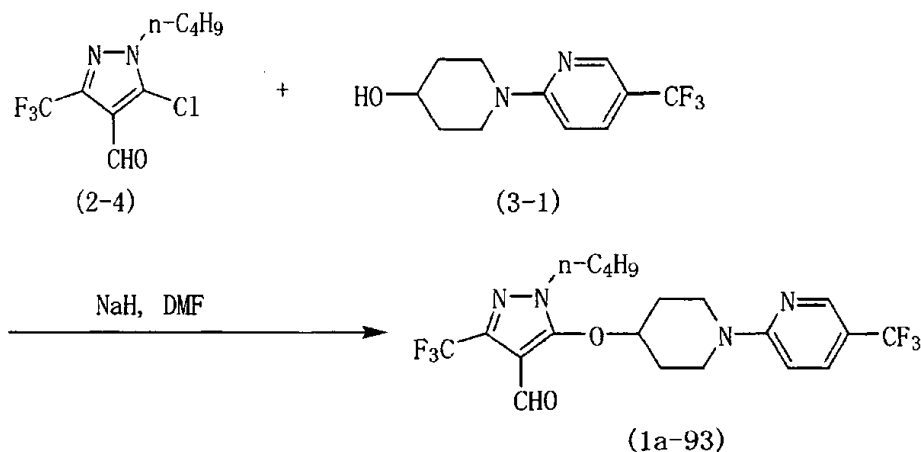
10

15

Ejemplo 9 de producción

Producción de 4-[1-butil-4-formil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-93)

20



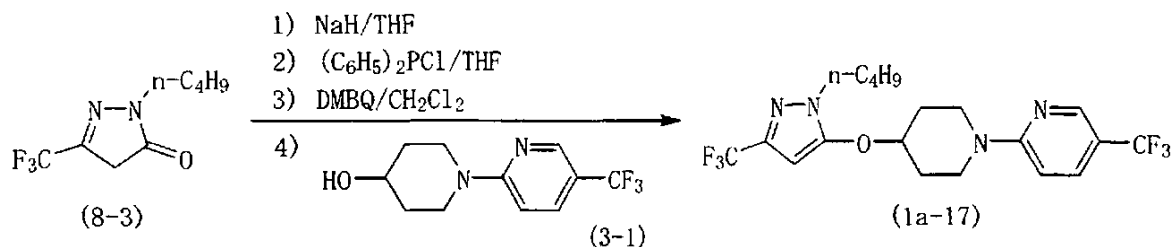
Se añadieron 0,22 g de hidruro de sodio al 60% a una disolución de 1,12 g de 1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-1-ol (3-1) en 5 ml de DMF anhidra. La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 15 minutos. Se le añadió una disolución de 1,12 g de 5-cloro-1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-4-carbaldehído (2-4) en 5 ml de DMF anhidra. La mezcla se agitó a 100°C durante 3 horas. La mezcla de reacción se vertió en 100 ml de agua, y se extrajo dos veces con 50 ml de acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1) para producir 0,56 g de Compuesto (1a-93).

25

30

Ejemplo 10 de producción

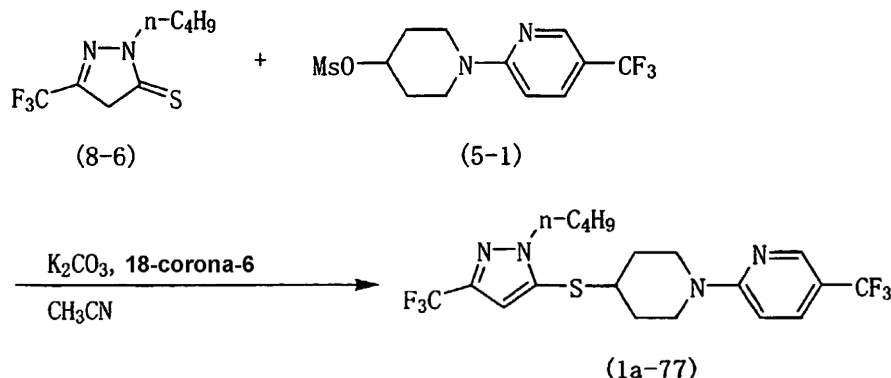
Producción de 4-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-17)



5 Se añadieron 0,02 g de hidruro de sodio al 60% a una disolución de 0,10 g de 1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ona (8-3) en 3 ml de tetrahidrofurfano anhidro (THF). La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 1 hora, y después se enfrió hasta 0°C. Se añadió gota a gota una disolución de 0,09 g de clorodifenilfosfina en 3 ml de THF anhidro. Tras agitar la mezcla a la temperatura ambiente durante 1 hora, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en 3 ml de diclorometano. Se le añadieron 0,06 g de 2,6-dimetil-1,4-benzoquinona (DMBQ) y 0,10 g de compuesto (3-1). La mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 18 horas. La disolución de la reacción se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 10:1) para producir 0,06 g de Compuesto (1a-17).

Ejemplo 11 de producción

15 Producción de 4-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iltio]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-77)

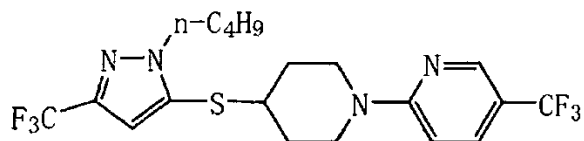


(en el que MsO es como se define anteriormente).

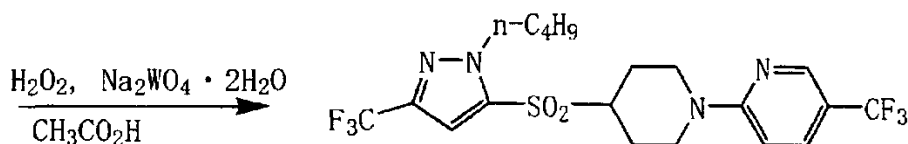
20 Se suspendieron 0,73 g de Compuesto (8-6), 1,27 g de Compuesto (5-1), 1,35 g de carbonato de potasio, y una cantidad catalítica de 18-crown-6, en 20 ml de acetonitrilo. La suspensión se agitó durante 1 hora a la temperatura ambiente, y después se calentó a reflujo durante dos horas y media. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Después de que se añadió agua al residuo, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 \rightarrow 6:1) para producir 0,51 g de Compuesto (1a-77).

Ejemplo 12 de producción

30 Producción de 4-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilsulfonil]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-218)



(1a-77)

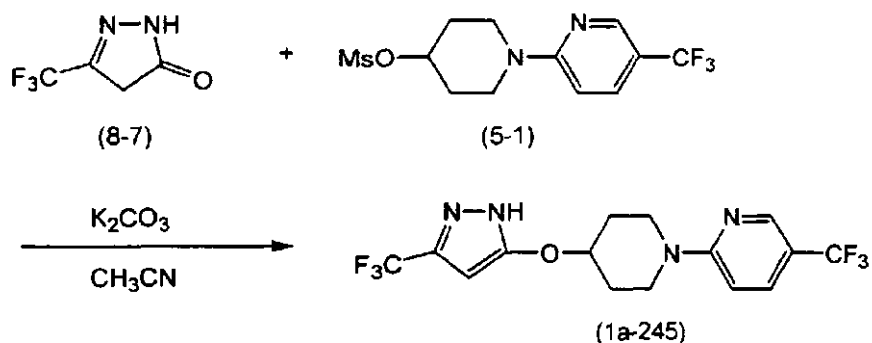


(1a-218)

Se disolvieron 0,40 g de Compuesto (1a-77) en 20 ml de ácido acético. Mientras se agita, se añadieron secuencialmente 0,40 g de una disolución al 30% de peróxido de hidrógeno y 0,03 g de volfrato de sodio dihidratado. Tras agitar la mezcla a la temperatura ambiente durante 7 horas, la mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con hidrogenocarbonato de sodio saturado, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 → 3:1) para producir 0,10 g de Compuesto (1a-218).

Ejemplo 13

Producción de 4-[3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº: 1a-245)

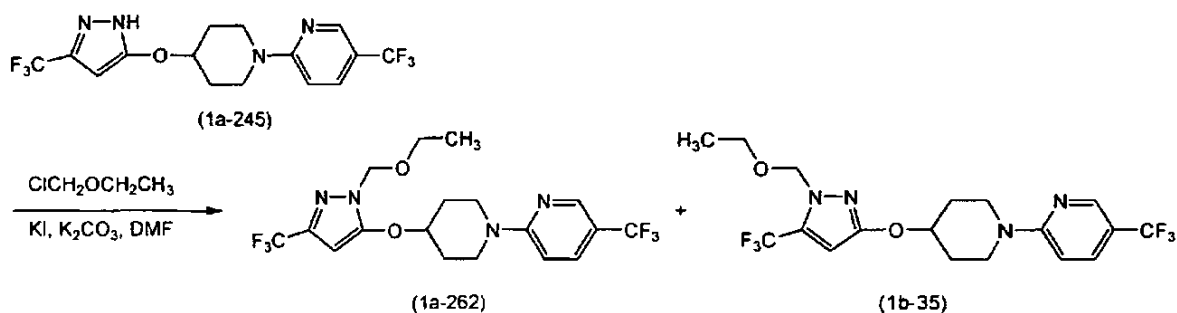


(en el que MsO es como se define anteriormente).

Se suspendieron 7,10 g de 3-(trifluorometil)pirazol-5-ona (8-7), 10,1 g de metanosulfonato de 1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-4-ilo (5-1), y 8,61 g de carbonato de potasio en 50 ml de acetonitrilo. Mientras se calentaba a reflujo, la suspensión se agitó durante 20 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Después de que se añadió acetato de etilo al residuo, la mezcla se lavó con agua y disolución salina saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 7:1 → 4:1) para producir 6,05 g de Compuesto (1a-245).

Ejemplo 14

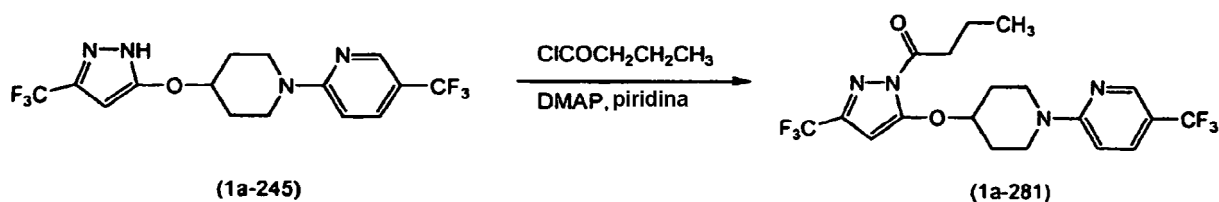
Producción de 4-[1-etoximetil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-262), y 4-[1-etoximetil-5-(trifluorometil)pirazol-3-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1b-35)



Se añadieron 0,5 g de clorometil etil éter, 0,73 g de carbonato de potasio, y 0,09 g de yodo de potasio a una disolución de 1,0 g de compuesto (1a-245) en 5 ml de DMF. La mezcla se agitó a 100°C durante un día. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y disolución salina saturada, después se secaron sobre sulfato de magnesio, y se filtraron. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (n-hexano:acetato de etilo = 6:1 → 4:1) para producir 0,17 g de Compuesto (1a-262) y 0,30 g de Compuesto (1b-35).

10 Ejemplo 15

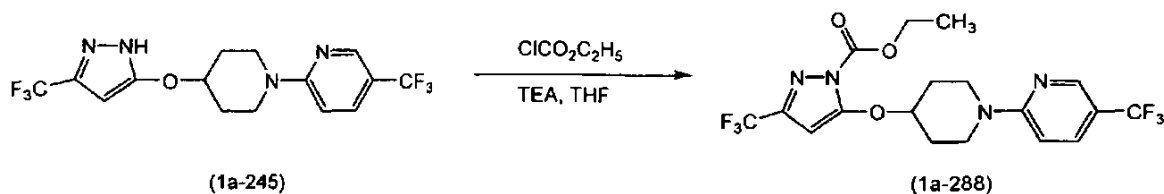
Producción de 4-[1-butiril-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-281)



Se añadieron 0,02 g de dimetilaminopiridina (DMAP) a una disolución de 0,5 g de Compuesto (1a-245) en 5 ml de piridina. Mientras se enfriaba con hielo, se añadieron gota a gota 0,17 g de cloruro de butirilo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas, y se concentró a presión reducida. Después de que se añadió agua al residuo, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y disolución salina saturada, después se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 → 4:1) para producir 0,30 g de Compuesto (1a-281).

25 Ejemplo 16

Producción de 4-[1-etoxicarbonil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº: 1a-288)

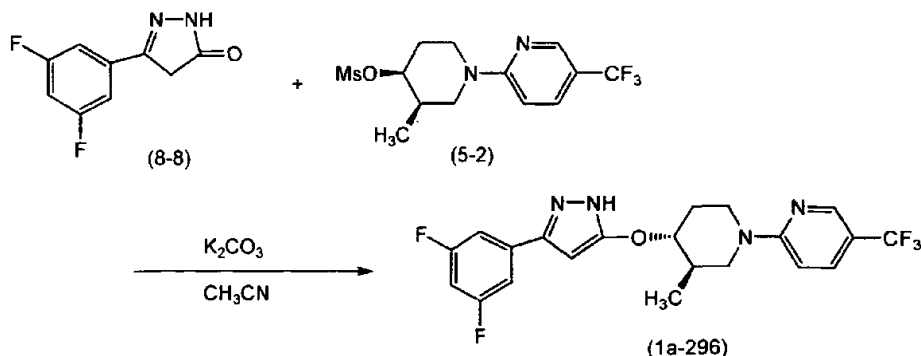


Se añadieron 0,18 g de cloroformiato de etilo a una disolución de 0,5 g de Compuesto (1a-245) en 10 ml de THF. Mientras se enfriaba con hielo, se añadieron gota a gota 0,2 g de trietilamina (TEA). La mezcla obtenida se agitó a 0°C durante 1 hora. Posteriormente, la mezcla se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 4:1 → 2:1) para producir 0,56 g de Compuesto (1a-288).

Ejemplo 17

Producción de trans-4-[3-(3,5-difluorofenil)pirazol-5-iloxi]-3-metil-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-296)

5



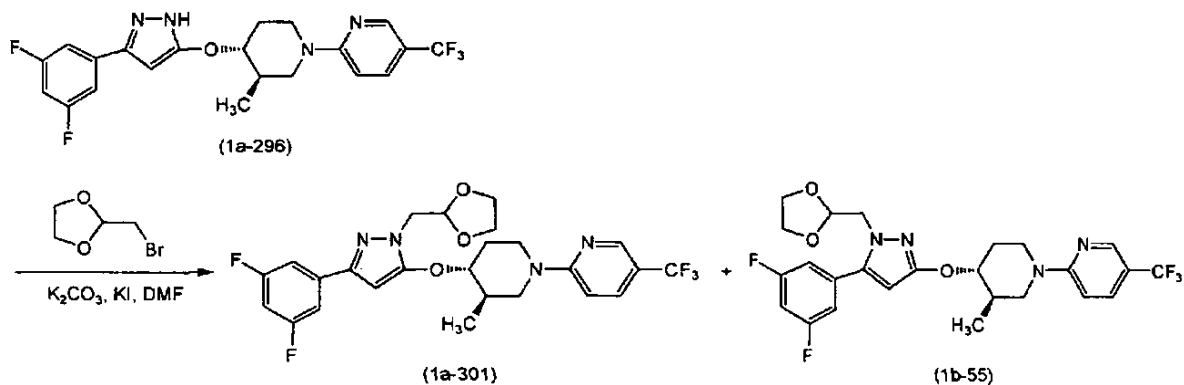
(en el que MsO es como se define anteriormente).

- 10 Se suspendieron 3,22 g de 3-(3,5-difluorofenil)pirazol-5-ona (8-8), 4,55 g de metanosulfonato de trans-3-metil-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidin-4-ilo (5-2), y 3,63 g de carbonato de potasio en 650 ml de acetonitrilo. Mientras se calentaba a reflujo, la suspensión se agitó durante 7 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Después se añadió acetato de etilo al residuo, la mezcla se lavó con agua y disolución salina saturada. La capa orgánica se seccó sobre sulfato de magnesio, y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (n-hexano:acetato de etilo = 4:1 → 3:1) para producir 1,51 g de Compuesto (1a-296).

15

Ejemplo 18

- 20 Producción de trans-4-[1-(1,3-dioxolan-2-il)metil]-3-(3,5-difluorofenil)pirazol-5-iloxi]-3-metil-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº: 1a-301), y trans-4-[1-(1,3-dioxolan-2-il)metil]-5-(3,5-difluorofenil)pirazol-3-iloxi]-3-metil-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1b-55)



25

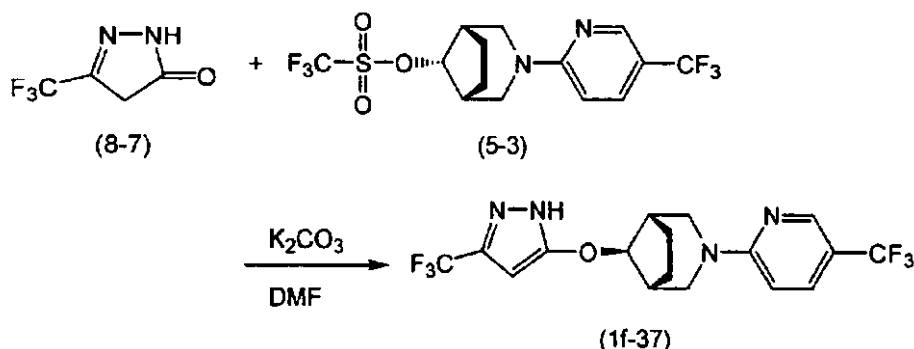
- Se añadieron 1,4 g de carbonato de potasio y 0,2 g de yoduro de potasio a una disolución de 0,46 g de compuesto (1a-296) en 30 ml de DMF. La mezcla se agitó a 100°C durante 30 minutos. La mezcla obtenida se enfrió con hielo, y se añadió una disolución de 1,4 g de 2-bromometil-1,3-dioxolano en 10 ml de DMF. La mezcla se agitó a 110°C durante 12 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo 3 veces con éter dietílico. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y disolución salina saturada, se secaron sobre sulfato de magnesio, y se filtraron. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida en columna (cloroforno:n-hexano:acetato de etilo = 5:4:1) para producir 0,17 g de Compuesto (1a-301) y 0,31 g de Compuesto (1b-55).

30

Ejemplo 19

Producción de 8-β-[3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1f-37)

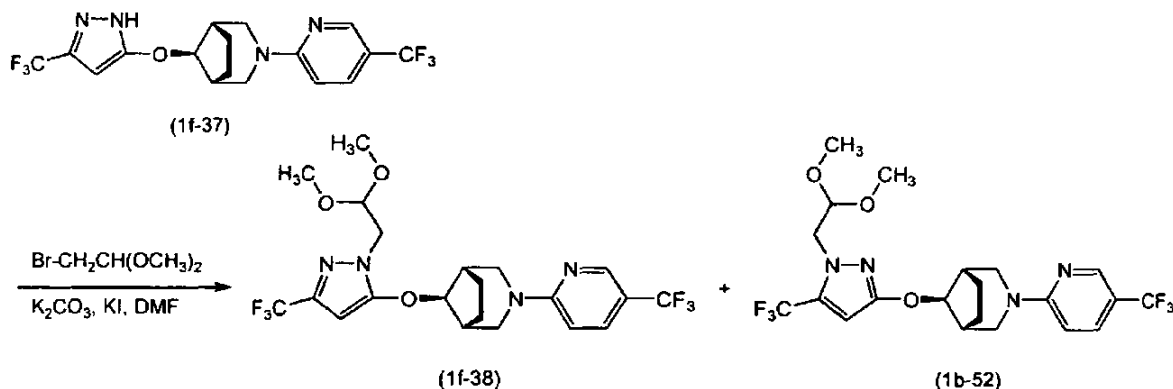
35



Se agitaron a temperatura ambiente durante 5 minutos, 79 g de 3-(trifluorometil)pirazol-5-ona (8-7), y una disolución de 1,43 g de carbonato de potasio en 30 ml de DMF. A esta mezcla se añadió una disolución de 1,40 g de trifluorometanosulfonato de 1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octan-8-ilo (5-3) en 10 ml de DMF. La mezcla se agitó a 50°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron dos veces con agua, y después se lavaron con disolución salina saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 4:1) para producir 0,61 g de Compuesto (1f-37).

Ejemplo 20

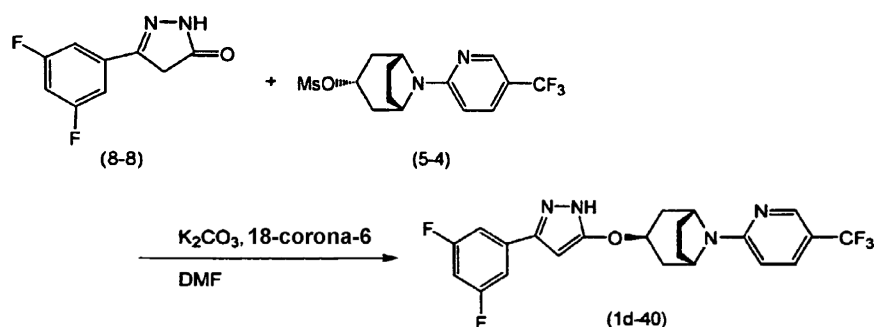
Producción de 8-β-[1-(2,2-dimetoxi)etil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1f-38) y 8-β-[1-(2,2-dimetoxi)etil-5-(trifluorometil)pirazol-3-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1b-52)



Se añadieron 0,58 g de carbonato de potasio y 0,1 g de yoduro de potasio a una disolución de 0,57 g de Compuesto (1f-37) en 30 ml de DMF. La mezcla se agitó a 100°C durante 30 minutos. La mezcla se enfrió con hielo, y se añadió una disolución de 0,71 g de 2-bromoacetaldehído en 10 ml de DMF. La mezcla se agitó a 100°C durante 7 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron dos veces con agua, y después se lavaron con disolución salina saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (n-hexano:acetato de etilo = 4:1 → 3:1) para producir 0,32 g de Compuesto (1f-38) y 0,19 g de Compuesto (1b-52).

Ejemplo 21

Producción de 3-α-[3-(3,5-difluorofenil)pirazol-5-iloxi]-N-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-8-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1d-40)

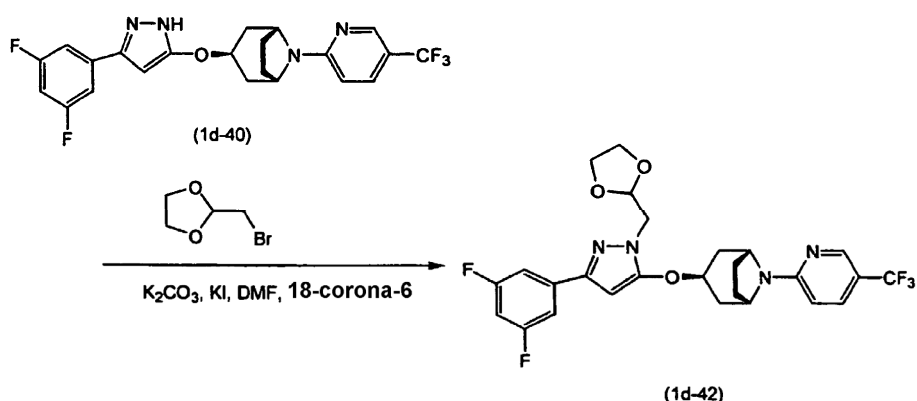


(en el que MsO es como se define anteriormente).

- 5 Se suspendieron 2,5 g de metanosulfonato de N-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-ilo (5-4), 1,5 g de 3-(3,5-difluorofenil)pirazol-5-ona (8-8), 1,5 g de carbonato de potasio, y una cantidad catalítica de 18-corona-6, en 50 ml de DMF. La suspensión se calentó a reflujo toda la noche. Se añadió una disolución acuosa de cloruro de amonio a la mezcla de reacción, y la mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron dos veces con agua, y después se lavaron con disolución salina saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 2:1) para producir 2,0 g de Compuesto (1d-40).

Ejemplo 22

- 15 Producción de 3- α -[1-(1,3-dioxolan-2-yl)metil]-3-(3,5-difluorofenil)pirazol-5-iloxi-N-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-8-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1d-42)

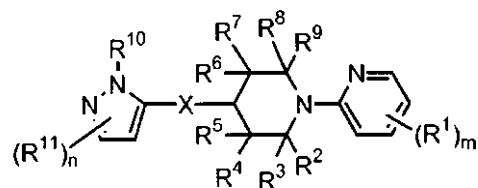


- 20 Una disolución de 0,93 g de 2-bromometil-1,3-dioxolano en 10 ml de DMF se añadió a una disolución de 0,5 g de Compuesto (1d-40), 0,23 g de carbonato de potasio, 0,20 g de yoduro de potasio, y una cantidad catalítica de 18-corona-6 en 30 ml de DMF. Mientras se calentaba a reflujo, la mezcla se agitó toda la noche. Se añadió una disolución acuosa de cloruro de amonio a la mezcla de reacción, y la mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron dos veces con agua, y después se lavaron con disolución salina saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida en columna (n-hexano:acetato de etilo = 5:1) para producir 0,25 g de Compuesto (1d-42).

- 30 Las Tablas 1 a 66 más abajo muestran compuestos producidos según los métodos descritos en los Ejemplos de Producción anteriores, y las propiedades físicas de los compuestos. Las abreviaturas usadas en las Tablas 1 a 66 se explican a continuación. Me: metilo, Et: etilo, n-Pr: n-propilo, i-Pr: isopropilo, c-Pr: ciclopropilo, n-Bu: n-butilo, i-Bu: isobutilo, s-Bu: sec-butilo, t-Bu: terc-butilo, c-Bu: ciclobutilo, n-Pen: n-pentilo, i-Pen: isopentilo, c-Pen: ciclopentilo, n-Hex: n-hexilo, c-Hex: ciclohexilo, n-Hept: n-heptilo, c-Hept: cicloheptilo, n-Oct: n-octilo, c-Oct: ciclooctilo, n-Non: n-nonilo, n-Dec: n-decilo, F: fenilo, Bn: bencilo, Py: piridilo.

Los espectros de RMN ^1H se determinaron usando tetrametilsilano (TMS) como material de referencia.

Tabla 1



(1 a)

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-1	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-Me	O	
1a-2	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me	O	
1a-3	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-Me	O	
1a-4	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	3-Me	O	
1a-5	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Me-Ph	3-Me	O	
1a-6	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-Cl	O	
1a-7	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-Br	O	
1a-8	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CN	O	
1a-9	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CO ₂ Et	O	
1a-10	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CONEt ₂	O	
1a-11	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CHO	O	
1a-12	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CHNOMe	O	
1a-13	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CHNOBn	O	
1a-14	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-15	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-16	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-17	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	

Tabla 2

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-18	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-19	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-20	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hept	3-CF ₃	O	
1a-21	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Oct	3-CF ₃	O	
1a-22	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Non	3-CF ₃	O	
1a-23	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Dec	3-CF ₃	O	
1a-24	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	i-Pr	3-CF ₃	O	
1a-25	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	i-Bu	3-CF ₃	O	
1a-26	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	t-Bu	3-CF ₃	O	
1a-27	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	s-Bu	3-CF ₃	O	
1a-28	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH=CH ₂	3-CF ₃	O	
1a-29	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ C≡CH	3-CF ₃	O	
1a-30	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ C≡CCH ₃	3-CF ₃	O	
1a-31	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CONMe ₂	3-CF ₃	O	
1a-32	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ NO ₂	3-CF ₃	O	
1a-33	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CN	3-CF ₃	O	
1a-34	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-35	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-36	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OBn	3-CF ₃	O	
1a-37	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (2-Py)	3-CF ₃	O	
1a-38	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (3-Py)	3-CF ₃	O	
1a-39	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (4-Py)	3-CF ₃	O	

ES 2 382 481 T3




n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-40	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-41	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-42	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-43	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (c-Pr)	3-CF ₃	O	

Tabla 3


n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-44	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (c-Hex)	3-CF ₃	O	
1a-45	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	O	
1a-46	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₃ CF ₃	3-CF ₃	O	
1a-47	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ CH=CF ₂	3-CF ₃	O	
1a-48	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ CF=CF ₂	3-CF ₃	O	
1a-49	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-50	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Bn	3-CF ₃	O	
1a-51	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Cl-Bn	3-CF ₃	O	
1a-52	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Bn	3-CF ₃	O	
1a-53	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	4-Cl-Bn	3-CF ₃	O	
1a-54	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-55	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-56	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,5-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-57	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-58	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-59	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,5-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-60	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Ph	3-CF ₃	O	
1a-61	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-62	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-63	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	4-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-64	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-65	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-66	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,5-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-67	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-68	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-69	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-70	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	
1a-71	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	6-Cl-2-Py	3-CF ₃	O	
1a-72	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Py	3-CF ₃	O	

Tabla 4

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-73	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	4-Py	3-CF ₃	O	
1a-74	5-CF ₃	Me	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-75	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-76	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-77	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	S	
1a-78	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Cl	O	
1a-79	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Cl	O	
1a-80	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Br	O	
1a-81	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Br	O	
1a-82	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Ph	O	
1a-83	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CN	O	
1a-84	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
											4-CO ₂ Et		
1a-85	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CONEt ₂	O	
1a-86	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHO	O	
1a-87	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHNOMe	O	
1a-88	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHNOBn	O	
1a-89	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Ph	O	

Nota 1: Una relación cis entre el sustituyente (grupo metilo) de R⁴ y X=O.

Nota 2: Una relación trans entre el sustituyente (grupo metilo) de R⁴ y X=O.

Tabla 5

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-90	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CN	O	
1a-91	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CO ₂ Et	O	
1a-92	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CONEt ₂	O	
1a-93	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CHO	O	
1a-94	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CHNOMe	O	
1a-95	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CHNOBn	O	
1a-96	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Ph	O	
1a-97	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-Cl-Ph)	O	
1a-98	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3-Cl-Ph)	O	
1a-99	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-Cl-Ph)	O	
1a-100	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-Cl-Ph)	O	
1a-101	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,3-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-102	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(2,4-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-103	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,4-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-104	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-105	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,6-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-106	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,4-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-107	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-108	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-109	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Cl	O	
1a-110	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Br	O	

Tabla 6

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-111	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CN	O	
1a-112	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CO ₂ Et	O	
1a-113	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CONEt ₂	O	
1a-114	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHO	O	
1a-115	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOMe	O	
1a-116	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOBn	O	

ES 2 382 481 T3

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-117	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Cl	O	
1a-118	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Br	O	
1a-119	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CN	O	
1a-120	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CO ₂ Et	O	
1a-121	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CONEt ₂	O	
1a-122	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHO	O	
1a-123	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOMe	O	
1a-124	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOBn	O	
1a-125	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	t-Bu	O	
1a-126	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	t-Bu	O	

Tabla 7

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-127	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-128	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-129	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-130	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-131	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-132	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-133	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-134	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-135	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-136	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-137	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-138	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-139	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-140	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-141	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-142	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-143	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-144	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-145	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-146	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-147	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	

Tabla 8

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-148	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	3-ClPh	3-CF ₃	O	
1a-149	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-150	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-151	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-Py)	O	
1a-152	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-Py)	O	
1a-153	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-Py)	O	
1a-154	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-CF ₃ -Ph)	O	

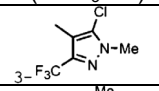
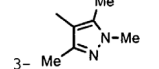
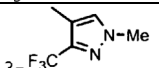
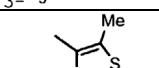
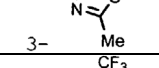
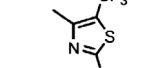
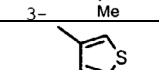
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-155	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-CF ₃ -Ph)	O	
1a-156	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-CF ₃ -Ph)	O	
1a-157	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-158	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-159	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-160	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-161	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-162	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-163	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	

Tabla 9

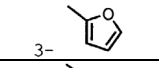
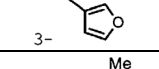
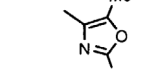
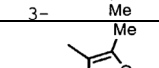
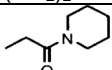
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-164	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-165	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-166	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-167	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-168	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Bu	3-CF ₃	O	
1a-169	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Pen	3-CF ₃	O	
1a-170	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Hex	3-CF ₃	O	
1a-171	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Hept	3-CF ₃	O	
1a-172	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Oct	3-CF ₃	O	
1a-173	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-174	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Me-Ph	3-CF ₃	O	
1a-175	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-176	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-177	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-178	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-179	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-180	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-181	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-182	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-183	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-184	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-COMe	O	

Tabla 10

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-185	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-COMe	O	
1a-186	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	

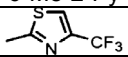
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
											4-CONHET		
1a-187	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CONHET	O	
1a-188	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-NO ₂	O	
1a-189	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-NO ₂	O	
1a-190	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-C(Me)NOMe	O	
1a-191	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-C(Me)NOBn	O	
1a-192	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-C(Me)NOMe	O	
1a-193	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-C(Me)NOBn	O	
1a-194	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	3-CF ₃	O	
1a-195	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OPh	3-CF ₃	O	
1a-196	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-197	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 3
1a-198	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 4
1a-199	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 5

Nota 3: Compuesto de hidrocloreuro

Nota 4: N-óxido de piperidilo

Nota 5: N-óxido de piperidilo

Tabla 11

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-200	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-201	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-202	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-203	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-204	5-CF ₃	H	H	n-Pr	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-205	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,4,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-206	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-207	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 1
1a-208	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 2
1a-209	5-CF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-2-Py	3-CF ₃	O	
1a-210	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	6-Me-2-Py	3-CF ₃	O	
1a-211	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-212	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-213	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-214	5-CF ₃	H	H	n-Pr	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-215	5-CF ₃	H	H	Me	Me	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-216	5-CF ₃	H	H	Me	Me	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-217	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	S	
1a-218	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	SO ₂	
1a-219	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Me	O	
1a-220	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CH ₂ OH	O	
1a-221	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Me	O	
1a-222	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHO	O	Nota 2

Nota 1: Una relación cis entre el sustituyente (grupo alquilo) de R⁴ y X=O.

Nota 2: Una relación trans entre el sustituyente (grupo alquilo) de R⁴ y X=O.

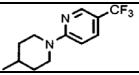
Tabla 12

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-223	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)	O	
1a-224	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-225	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 1
1a-226	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 2
1a-227	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 1
1a-228	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 2
1a-229	5-CF ₃	H	H	n-Pr	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 1
1a-230	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-231	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Hex	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 1
1a-232	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Hex	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 2
1a-233	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	O	
1a-234	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	O	Nota 2
1a-235	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-CN-Ph)	O	
1a-236	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-F-Ph)	O	
1a-237	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-t-Bu-Ph)	O	
1a-238	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-MeS-Ph)	O	
1a-239	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-NO ₂ -Ph)	O	
1a-240	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-CF ₃ -Ph)	O	
1a-241	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-MeO-Ph)	O	
1a-242	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-CF ₃ O-Ph)	O	
1a-243	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CO ₂ Et 4-Me	O	
1a-244	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-C1	O	

Nota 1: Una relación cis entre el sustituyente (grupo alquilo) de R⁴ y X=O.

Nota 2: Una relación trans entre el sustituyente (grupo alquilo) de R⁴ y X=O.

Tabla 13

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-245	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	3-CF ₃	O	
1a-246	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	H	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-247	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	5-Me-2-Py	-3-CF ₃	O	
1a-248	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Me ₂ -Ph)	O	
1a-249	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,6-Cl ₂ -4-Py)	O	
1a-250	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CO(t-Bu)	3-CF ₃	O	
1a-251	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	Ph	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-252	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	3-Me-Ph	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-253	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-F-5-CF ₃ -Ph)	O	
1a-254	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-F-Ph)	O	
1a-255	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-Me-Ph)	O	
1a-256	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-257	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	O	Nota 2
1a-258	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-I-Ph)	O	
1a-259	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-260	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-261	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-262	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-263	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	-CH ₂ OEt	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-264	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-265	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-266	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH(OMe) ₂	3-CF ₃	O	
1a-267	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH(OMe) ₂	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-268	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH(OMe) ₂	3-CF ₃	O	Nota 1

Nota 1: Una relación cis entre el sustituyente (grupo metilo) de R⁴ y X=O.

Nota 2: Una relación trans entre el sustituyente (grupo metilo) de R⁴ y X=O.

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
											4-CO ₂ Et		
1a-85	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CONEt ₂	O	
1a-86	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHO	O	
1a-87	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHNOMe	O	
1a-88	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHNOBn	O	
1a-89	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Ph	O	

Nota 1: Una relación cis entre el sustituyente (grupo metilo) de R⁴ y X=O.

Nota 2: Una relación trans entre el sustituyente (grupo metilo) de R⁴ y X=O.

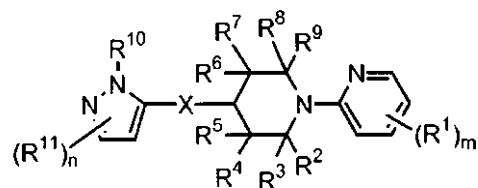
Tabla 5

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-90	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CN	O	
1a-91	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CO ₂ Et	O	
1a-92	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CONEt ₂	O	
1a-93	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CHO	O	
1a-94	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CHNOMe	O	
1a-95	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CHNOBn	O	
1a-96	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Ph	O	
1a-97	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-Cl-Ph)	O	
1a-98	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3-Cl-Ph)	O	
1a-99	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-Cl-Ph)	O	
1a-100	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-Cl-Ph)	O	
1a-101	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,3-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-102	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(2,4-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-103	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,4-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-104	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-105	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2,6-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-106	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,4-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-107	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-108	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	O	
1a-109	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Cl	O	
1a-110	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Br	O	

Tabla 6

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-111	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CN	O	
1a-112	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CO ₂ Et	O	
1a-113	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CONEt ₂	O	
1a-114	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHO	O	
1a-115	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOMe	O	
1a-116	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOBn	O	

Tabla 1



(1 a)

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-1	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-Me	O	
1a-2	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me	O	
1a-3	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-Me	O	
1a-4	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	3-Me	O	
1a-5	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Me-Ph	3-Me	O	
1a-6	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-Cl	O	
1a-7	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-Br	O	
1a-8	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CN	O	
1a-9	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CO ₂ Et	O	
1a-10	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CONEt ₂	O	
1a-11	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CHO	O	
1a-12	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CHNOMe	O	
1a-13	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me 4-CHNOBn	O	
1a-14	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-15	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-16	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-17	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	

Tabla 2

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-18	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-19	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-20	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hept	3-CF ₃	O	
1a-21	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Oct	3-CF ₃	O	
1a-22	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Non	3-CF ₃	O	
1a-23	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Dec	3-CF ₃	O	
1a-24	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	i-Pr	3-CF ₃	O	
1a-25	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	i-Bu	3-CF ₃	O	
1a-26	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	t-Bu	3-CF ₃	O	
1a-27	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	s-Bu	3-CF ₃	O	
1a-28	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH=CH ₂	3-CF ₃	O	
1a-29	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ C≡CH	3-CF ₃	O	
1a-30	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ C≡CCH ₃	3-CF ₃	O	
1a-31	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CONMe ₂	3-CF ₃	O	
1a-32	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ NO ₂	3-CF ₃	O	
1a-33	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CN	3-CF ₃	O	
1a-34	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-35	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-36	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ OBn	3-CF ₃	O	
1a-37	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (2-Py)	3-CF ₃	O	
1a-38	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (3-Py)	3-CF ₃	O	
1a-39	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (4-Py)	3-CF ₃	O	

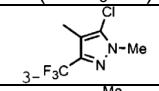
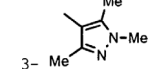
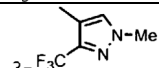
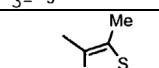
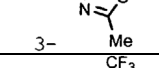
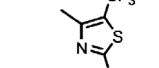
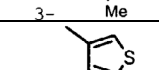
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-155	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-CF ₃ -Ph)	O	
1a-156	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-CF ₃ -Ph)	O	
1a-157	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-158	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-159	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-160	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-161	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-162	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-163	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	

Tabla 9

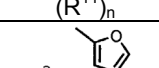
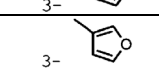
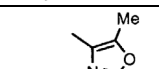
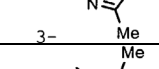
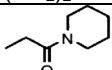
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-164	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-165	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-166	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-167	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu		O	
1a-168	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Bu	3-CF ₃	O	
1a-169	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Pen	3-CF ₃	O	
1a-170	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Hex	3-CF ₃	O	
1a-171	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Hept	3-CF ₃	O	
1a-172	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	c-Oct	3-CF ₃	O	
1a-173	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-174	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Me-Ph	3-CF ₃	O	
1a-175	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-176	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-177	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-178	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-179	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-180	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-181	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-182	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-183	5-CO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-184	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-COMe	O	

Tabla 10

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-185	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-COMe	O	
1a-186	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	

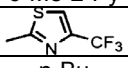
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
											4-CONHET		
1a-187	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-CONHET	O	
1a-188	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-NO ₂	O	
1a-189	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-NO ₂	O	
1a-190	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-C(Me)NOMe	O	
1a-191	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-C(Me)NOBn	O	
1a-192	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-C(Me)NOMe	O	
1a-193	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-C(Me)NOBn	O	
1a-194	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	3-CF ₃	O	
1a-195	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OPh	3-CF ₃	O	
1a-196	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-197	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 3
1a-198	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 4
1a-199	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 5

Nota 3: Compuesto de hidrocloreuro

Nota 4: N-óxido de piperidilo

Nota 5: N-óxido de piperidilo

Tabla 11

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-200	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-201	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-202	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-203	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-204	5-CF ₃	H	H	n-Pr	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-205	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,4,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-206	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	
1a-207	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 1
1a-208	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	2-Py	3-(3,5-F ₂ -Ph)	O	Nota 2
1a-209	5-CF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-2-Py	3-CF ₃	O	
1a-210	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	6-Me-2-Py	3-CF ₃	O	
1a-211	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-212	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-213	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-214	5-CF ₃	H	H	n-Pr	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-215	5-CF ₃	H	H	Me	Me	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-216	5-CF ₃	H	H	Me	Me	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-217	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	S	
1a-218	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	SO ₂	
1a-219	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Me	O	
1a-220	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CH ₂ OH	O	
1a-221	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Me	O	
1a-222	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CHO	O	Nota 2

Nota 1: Una relación cis entre el sustituyente (grupo alquilo) de R⁴ y X=O.

Nota 2: Una relación trans entre el sustituyente (grupo alquilo) de R⁴ y X=O.

ES 2 382 481 T3

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-117	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Cl	O	
1a-118	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-Br	O	
1a-119	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CN	O	
1a-120	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CO ₂ Et	O	
1a-121	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CONEt ₂	O	
1a-122	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHO	O	
1a-123	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOMe	O	
1a-124	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3,5-Cl ₂ -Ph) 4-CHNOBn	O	
1a-125	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	t-Bu	O	
1a-126	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	t-Bu	O	

Tabla 7

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-127	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-128	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-129	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-130	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-131	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-132	5-CN	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-133	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-134	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-135	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-136	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-137	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-138	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	
1a-139	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-140	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-141	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-142	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1a-143	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	
1a-144	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	
1a-145	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-146	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	
1a-147	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	

Tabla 8

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-148	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	3-ClPh	3-CF ₃	O	
1a-149	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	
1a-150	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	
1a-151	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-Py)	O	
1a-152	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-Py)	O	
1a-153	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-Py)	O	
1a-154	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-CF ₃ -Ph)	O	

ES 2 382 481 T3




n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-40	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-41	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-42	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-43	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (c-Pr)	3-CF ₃	O	

Tabla 3


n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-44	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ (c-Hex)	3-CF ₃	O	
1a-45	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	O	
1a-46	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₃ CF ₃	3-CF ₃	O	
1a-47	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ CH=CF ₂	3-CF ₃	O	
1a-48	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ CF=CF ₂	3-CF ₃	O	
1a-49	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H		3-CF ₃	O	
1a-50	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Bn	3-CF ₃	O	
1a-51	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Cl-Bn	3-CF ₃	O	
1a-52	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Bn	3-CF ₃	O	
1a-53	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	4-Cl-Bn	3-CF ₃	O	
1a-54	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-55	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-56	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,5-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-57	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-58	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-59	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,5-Cl ₂ -Bn	3-CF ₃	O	
1a-60	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Ph	3-CF ₃	O	
1a-61	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-62	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-63	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	4-Cl-Ph	3-CF ₃	O	
1a-64	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-65	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-66	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,5-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-67	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-68	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-69	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	3-CF ₃	O	
1a-70	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	2-Py	3-CF ₃	O	
1a-71	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	6-Cl-2-Py	3-CF ₃	O	
1a-72	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	3-Py	3-CF ₃	O	

Tabla 4

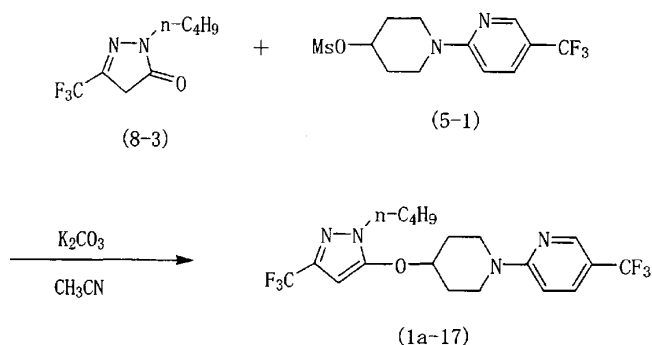
n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Observaciones
1a-73	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	4-Py	3-CF ₃	O	
1a-74	5-CF ₃	Me	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	
1a-75	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 1
1a-76	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	Nota 2
1a-77	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	S	
1a-78	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Cl	O	
1a-79	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Cl	O	
1a-80	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-Br	O	
1a-81	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Br	O	
1a-82	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Ph	O	
1a-83	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃ 4-CN	O	
1a-84	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	

hasta la temperatura ambiente, y después se filtró a través de celita. El filtrado se concentró a presión reducida. Después de que se añadió agua al residuo, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 9:1 → 4:1) para producir 0,20 g de Compuesto (1a-62).

5

Ejemplo 3 de producción

Producción de 4-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-piperidina (Compuesto nº 1a-17)



10

(en el que MsO es como se define anteriormente).

0,31 g de 1-butil-3-(trifluorometil)pirazolin-5-ona (8-3), 0,49 g de Compuesto (5-1), y 0,41 g de carbonato de potasio se suspendieron en 20 ml de acetonitrilo. La mezcla resultante se calentó a reflujo toda la noche, se enfrió hasta la temperatura ambiente, y después se filtró a través de celita. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 1:0 → 8:1) para producir 0,42 g de Compuesto (1a-17).

20 Ejemplo 4 de producción

Producción de 8 β-[1-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-iloxi]-1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (Compuesto nº 1f-6)

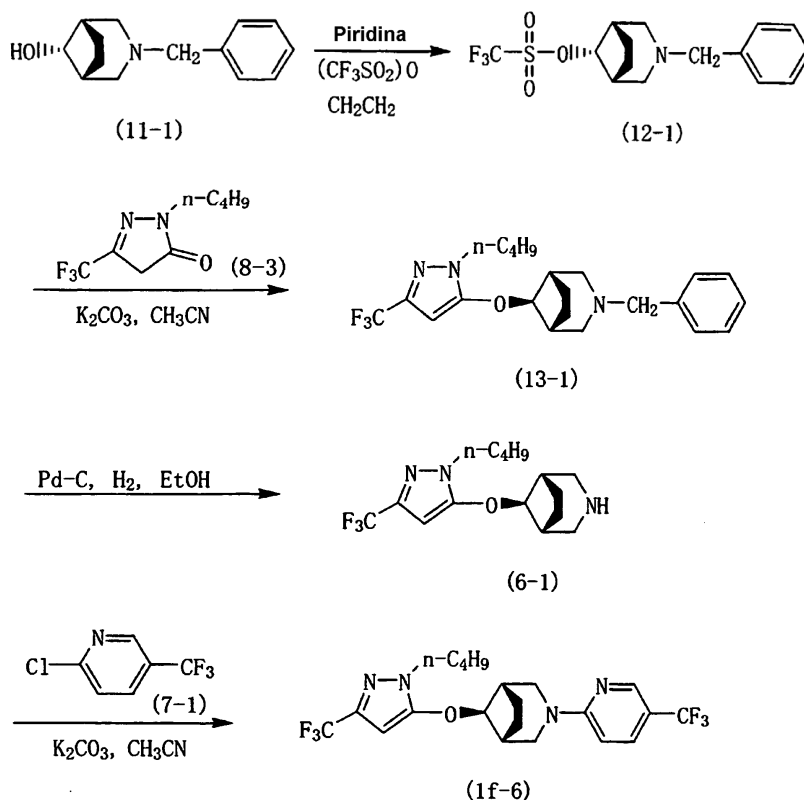
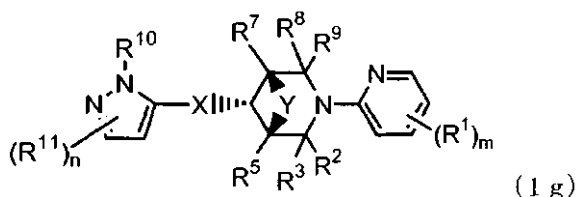


Tabla 27



n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Y
1g-1	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	Me	3-Me	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-2	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Me	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-3	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-4	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	Et	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-5	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Pr	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-6	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-7	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-8	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Hex	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-9	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Hept	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-10	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Oct	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-11	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Non	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-12	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Dec	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-13	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	i-Pr	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-14	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	i-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-15	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	t-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-16	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	s-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-17	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	Ph	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-18	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-Ph	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-19	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-20	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	4-Cl-Ph	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-21	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	Bn	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-22	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OMe	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-23	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ OEt	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-24	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	S	-CH ₂ CH ₂ -
1g-25	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Pen	3-CF ₃	S	-CH ₂ CH ₂ -

Tabla 28

n°	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	(R ¹¹) _n	X	Y
1g-26	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	3-Cl-Ph	3-CF ₃	S	-CH ₂ CH ₂ -
1g-27	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Cl	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-28	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Br	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-29	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃ 4-Ph	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-30	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-Ph	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-31	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(2-Cl-Ph)	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-32	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(3-Cl-Ph)	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-33	5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-(4-Cl-Ph)	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-34	5-CN	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-35	3-Cl 5-CF ₃	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -
1g-36	5-NO ₂	H	H	H	H	H	H	n-Bu	3-CF ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -

Tabla 29

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	Datos RMN ¹ H
1a-1	Líquido viscoso	δ 8,40 (se udo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,34 (s, 1H), 4,46-4,35 (m, 1H), 3,96-3,85 (m, 2H), 3,68-3,59 (m, 2H), 3,58 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,09-1,99 (m, 2H), 1,94-1,83 (m, 2H)

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	Datos RMN ¹ H
1a-2	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,32 (s, 1H), 4,44-4,36 (m, 1H), 3,95-3,84 (m, 4H), 3,69-3,58 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,10-1,98 (m, 2H), 1,96-1,83 (m, 2H), 1,80-1,68 (m, 2H), 1,38-1,23 (m, 2H), 0,91 (t, J=7,4, 3H)
1a-14	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,52-4,45 (m, 1H), 4,11-3,91 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,66-3,56 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,97-1,87 (m, 2H)
1a-15	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,52-4,43 (m, 1H), 4,06 (q, J=7,2, 2H), 3,99-3,90 (m, 2H), 3,67-3,58 (m, 2H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,97-1,86 (m, 2H), 1,40 (t, J=7,2, 3H)
1a-16	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,54-4,45 (m, 1H), 4,01-3,90 (m, 4H), 3,68-3,58 (m, 2H), 2,15-2,04 (m, 2H), 1,97-1,77 (m, 4H), 0,90 (t, J=7,6, 3H)
1a-17	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,52-4,43 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,67-3,59 (m, 2H), 2,13-2,04 (m, 2H), 1,95-1,85 (m, 2H), 1,83-1,73 (m, 2H), 1,36-1,26 (m, 2H), 0,92 (t, J=7,4, 3H)
1a-18	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,53-4,44 (m, 1H), 3,99 (t, J=7,3, 2H), 3,97-3,89 (m, 2H), 3,67-3,58 (m, 2H), 2,14-2,03 (m, 2H), 1,96-1,85 (m, 2H), 1,85-1,74 (m, 2H), 1,37-1,22 (m, 4H), 0,87 (t, J=7,1, 3H)

Tabla 30

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-19	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,53-4,43 (m, 1H), 3,99 (t, J=7,3, 2H), 3,97-3,87 (m, 2H), 3,68-3,59 (m, 2H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,96-1,87 (m, 2H), 1,86-1,72 (m, 2H), 1,34-1,20 (m, 6H), 0,86 (t, J=6,9, 3H)
1a-24	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,62-4,44 (m, 2H), 3,97-3,88 (m, 2H), 3,68-3,59 (m, 2H), 2,15-2,05 (m, 2H), 1,97-1,87 (m, 2H), 1,45 (d, J=6,7, 6H)
1a-26	127,2-127,8	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,54-4,44 (m, 1H), 3,94-3,83 (m, 2H), 3,75-3,64 (m, 2H), 2,16-2,04 (m, 2H), 2,01-1,89 (m, 2H), 1,61 (s, 9H)
1a-28	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,90-5,87 (m, 1H), 5,83 (s, 1H), 5,82 (dd, J1=10,3, J2=1,2, 1H), 5,11 (dd, J1=17,1, J2=1,2, 1H), 4,64 (d, J=0,6, 2H), 4,54-4,44 (m, 1H), 3,94-3,84 (m, 2H), 3,70-3,60 (m, 2H), 2,13-2,02 (m, 2H), 1,96-1,85 (m, 2H)
1a-45	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,85 (s, 1H), 4,60 (q, J=8,2, 2H), 4,59-4,51 (m, 1H), 4,00-3,90 (m, 2H), 3,67-3,57 (m, 2H), 2,16-2,06 (m, 2H), 1,98-1,87 (m, 2H)
1a-46	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,82 (s, 1H), 4,52-4,46 (m, 1H), 4,13-4,05 (m, 2H), 4,01-3,93 (m, 2H), 3,63-3,55 (m, 2H), 2,18-2,04 (m, 6H), 1,94-1,84 (m, 2H)

Tabla 31

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-50	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 7,34-7,18 (m, 5H), 6,63 (d, J=9,0, 1H), 5,82 (s, 1H), 5,21 (s, 2H), 4,48-4,42 (m, 1H), 3,68-3,55 (m, 4H), 2,00-1,93 (m, 2H), 1,86-1,77 (m, 2H)
1a-51	Líquido viscoso	δ 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,36-7,33 (m, 1H), 7,22-7,17 (m, 2H), 6,88-6,84 (m, 1H), 6,63 (d, J=9,0, 1H), 5,87 (s, 1H), 5,36 (s, 2H), 4,50-4,45 (m, 1H), 3,71-3,64 (m, 2H), 3,62-3,55 (m, 2H), 2,02-1,94 (m, 2H), 1,85-1,78 (m, 2H)
1a-52	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,26-7,20 (m, 3H), 7,12-7,08 (m, 1H), 6,66 (d, J=9,0, 1H), 5,83 (s, 1H), 5,17 (s, 2H), 4,51-4,44 (m, 1H), 3,75-3,68 (m, 2H), 3,63-3,56 (m, 2H), 2,06-1,97 (m, 2H), 1,88-1,79 (m, 2H)
1a-53	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,28-7,24 (m, 2H),

ES 2 382 481 T3

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		7,16-7,13 (m, 2H), 6,65 (d, J=9,0, 1H), 5,83 (s, 1H), 5,16 (s, 2H), 4,50-4,43 (m, 1H), 3,74-3,67 (m, 2H), 3,61-3,54 (m, 2H), 2,05-1,97 (m, 2H), 1,87-1,78 (m, 2H)
1a-60	161,8-162,4	δ 8,40 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,72-7,66 (m, 2H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,49-7,41 (m, 2H), 7,34 (t, J=7,4, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 5,99 (s, 1H), 4,63-4,54 (m, 1H), 3,86-3,76 (m, 2H), 3,72-3,63 (m, 2H), 2,14-2,03 (m, 2H), 2,00-1,89 (m, 2H)
1a-61	Líquido viscoso	δ 8,37 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,61 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,52 (dd, J1=7,7, J2=1,6, 1H), 7,48-7,34 (m, 3H), 6,63 (d, J=9,0, 1H), 5,95 (s, 1H), 4,59-4,50 (m, 1H), 3,78-3,69 (m, 2H), 3,65-3,55 (m, 2H), 2,08-1,98 (m, 2H), 1,92-1,81 (m, 2H)
1a-62	86,4-87,3	δ 8,40 (s, 1H), 7,78 (seudo-t, J=1,9, 1H), 7,67-7,61 (m, 2H), 7,38 (seudo-t, J=8,1, 1H), 7,34-7,29 (m, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,65-4,56 (m, 1H), 3,89-3,80 (m, 2H), 3,73-3,64 (m, 2H), 2,16-2,06 (m, 2H), 2,02-1,91 (m, 2H)

Tabla 32

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-63	112,7-113,4	δ 8,40 (s, 1H), 7,68-7,61 (m, 3H), 7,45-7,39 (m, 2H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,63-4,55 (m, 1H), 3,88-3,78 (m, 2H), 3,71-3,61 (m, 2H), 2,15-2,05 (m, 2H), 1,99-1,88 (m, 2H)
1a-68	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,91 (d, J=2,4, 1H), 7,69-7,58 (m, 2H), 7,51 (d, J=8,7, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,65-4,57 (m, 1H), 3,91-3,81 (m, 2H), 3,73-3,62 (m, 2H), 2,18-2,07 (m, 2H), 2,02-1,90 (m, 2H)
1a-69	130,3-130,9	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,73 (d, J=1,8, 2H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,32 (t, J=1,8, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,67-4,58 (m, 1H), 3,92-3,81 (m, 2H), 3,75-3,65 (m, 2H), 2,19-2,08 (m, 2H), 2,04-1,92 (m, 2H)
1a-70	123,7-123,9	δ 8,57 (seudo-d, J=3,8, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,85 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,69 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,33-7,29 (m, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 6,01 (s, 1H), 4,68-4,62 (m, 1H), 3,88-3,81 (m, 2H), 3,75-3,68 (m, 2H), 2,12-2,04 (m, 2H), 2,03-1,94 (m, 2H)
1a-75	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,1, 1H), 5,77 (s, 1H), 4,44-4,41 (m, 1H), 4,12-3,95 (m, 4H), 3,43-3,32 (m, 1H), 3,30-3,20 (m, 1H), 2,20-2,06 (m, 2H), 1,92-1,66 (m, 3H), 1,40-1,28 (m, 2H), 1,09 (d, J=6,9, 3H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-76	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,34-4,24 (m, 2H), 4,23-3,94 (m, 3H), 3,28-3,18 (m, 1H), 2,97-2,87 (m, 1H), 2,28-2,19 (m, 1H), 2,07-1,97 (m, 1H), 1,82-1,64 (m, 3H), 1,37-1,21 (m, 2H), 1,12 (d, J=6,6, 3H), 0,92 (t, J=7,3, 3H)

Tabla 33

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	Datos RMN ¹ H
1a-77	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,65 (d, J=9,0, 1H), 6,62 (s, 1H), 4,44-4,25 (m, 4H), 3,23-3,07 (m, 3H), 2,05-1,99 (m, 2H), 1,88-1,79 (m, 2H), 1,69-1,58 (m, 2H), 1,39-1,29 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-79	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,1, 1H), 4,92-4,85 (m, 1H), 4,16-4,07 (m, 2H), 3,98 (t, J=7,3, 2H), 3,79-3,41 (m, 2H), 2,16-2,08 (m, 2H), 1,91-1,82 (m, 2H), 1,82-1,74 (m, 2H), 1,38-1,25 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-81	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 4,91-4,84 (m, 1H), 4,18-4,11 (m, 2H), 4,00 (t, J=7,3, 2H), 3,46-3,38 (m, 2H), 2,16-2,08 (m, 2H), 1,91-1,74 (m, 4H), 1,36-1,25 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-82	Líquido viscoso	δ 8,35 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,59 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,44-7,30 (m, 5H), 6,59 (d, J=9,0, 1H), 4,09-4,00 (m, 3H), 3,95-3,86 (m, 2H), 3,19-3,09 (m, 2H), 1,90-1,73 (m, 4H), 1,68-1,58 (m, 2H), 1,44-1,33 (m, 2H), 0,96 (t, J=7,4, 3H)
1a-86	80,8-81,3	δ 9,86 (s, 1H), 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,34-5,26 (m, 1H), 4,19-4,11 (m, 2H), 3,73 (s, 3H), 3,45-3,37 (m, 2H), 2,18-2,10 (m, 2H), 1,87-1,77 (m, 2H)
1a-87	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 4,96-4,87 (m, 1H), 4,25-4,18 (m, 2H), 3,94 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,37-3,30 (m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H), 1,90-1,81 (m, 2H)

ES 2 382 481 T3

Tabla 34

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-93	Líquido viscoso	δ 9,85 (d, J= 0,9, 1H), 8,41 (s eudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,34-5,26 (m, 1H), 4,18-4,11 (m, 2H), 4,01 (t, J=7,3, 2H), 3,44-3,36 (m, 2H), 2,18 2,10 (m, 2H), 1,86-1,75 (m, 4H), 1, 35-1,27 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-96	79,8-80,6	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,75 (seudo-d, J=7,0, 2H), 7,64 (dd, J1= 9,0, J2=2,4, 1H), 7,42-7,33 (m, 2H), 7,36 (t, J=7,3, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,84 (s, 1H), 4,57-4,47 (m, 1H), 4,01 (t, J=7,2, 2H), 3,98-3,86 (m, 2H), 3,73-3,60 (m, 2H), 2,15-2,04 (m, 2H), 1,98- 1,90 (m, 2H), 1,85-1,78 (m, 2H), 1,40- 1,29 (m, 2H), 0,94 (t, J= 7,4, 3H)
1a-97	77,4-78,0	δ 8,41 (seudo-d, J= 2,5, 1H), 7,81 (dd, J1=7,7, J2=1,8, 1H), 7,64 (d d, J1= 9,1, J2=2,5, 1H), 7,41 (dd, J1= 7,9, J2=1,3, 1H), 7,32-7,21 (m, 2H), 6,70 (d, J=9,1, 1H), 6,08 (s, 1H), 4,58-4,49 (m, 1H), 4,03 (t, J= 7,2, 2H), 3,97- 3,87 (m, 2H), 3,73-3,61 (m, 2H), 2,16-2,05 (m, 2H), 2,02-1,89 (m, 2H), 1,87- 1,77 (m, 2H), 1,42-1,31 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-98	97,2-97,7	δ 8,41 (s, 1H), 7,73 (d, J= 1,7, 1H), 7,68-7,61 (m, 2H), 7,34-7,22 (m, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,85 (s, 1H), 4,55-4,46 (m, 1H), 4,01-3,91 (m, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,69-3,59 (m, 2H), 2,16-2,06 (m, 2H), 2,00-1,89 (m, 2H)
1a-99	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,75 (seudo-t, J=1,8, 1H), 7,68-7,60 (m, 2H), 7,34-7,22 (m, 2H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,83 (s, 1H), 4,57- 4,47 (m, 1H), 4,00 (t, J= 7,2, 2H), 3,99-3,89 (m, 2H), 3,70-3,61 (m, 2H), 2,14-2,02 (m, 2H), 1,99-1,88 (m, 2H), 1,86-1,76 (m, 2H), 1,40-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)

Tabla 35

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-100	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,71-7,61 (m, 3H), 7,34 (dd, J1=6,6, J2=1,9, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,56-4,47 (m, 1H), 4,00 (t, J =7,1, 2H), 3,99-3,88 (m, 2H), 3,71- 3,60 (m, 2H), 2,15-2,05 (m, 2H), 2,00-1,90 (m, 2H), 1,86-1,75 (m, 2H), 1,40-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-101	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J= 2,4, 1H) , 7,69 (dd, J1=7,8, J2= 1,6, 1H), 7,64 (dd, J1= 9,0, J2=2,4, 1H), 7,41 (dd, J1=8,0, J2=1,6, 1H), 7,25-7,18 (m, 1H), 6,69 (d, J= 9,0, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,59-4,49 (m, 1H), 4,03 (t, J=7,1, 2H), 3,99-3,89 (m, 2H), 3,71-3,61 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 2,00-1,90 (m, 2H), 1,86- 1,76 (m, 2H), 1,40-1,31 (m, 2H) , 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-102	112,0-112,7	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,75 (d, J=8,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 7,44 (d, J= 2,1, 1H), 7,27 (dd, J1= 8,5, J2= 2,1, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 6,08 (s, 1H), 4,57-4,49 (m, 1H), 3,99-3,90 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 3,70-3,60 (m, 2H), 2,16-2,05 (m, 2H), 2,00-1,89 (m, 2H)
1a-103	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,78 (d, J=8,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,43 (d, J= 2,1, 1H), 7,26 (dd, J1= 8,4, J2= 2,1, 1H), 6,69 (d, J= 9,0, 1H), 6,07 (s, 1H), 4,58-4,48 (m, 1H), 4,02 (t, J= 7,1, 2H), 3,98-3,88 (m, 2H) , 3,70-3,61 (m, 2H), 2,14-2,05 (m, 2H), 2,00-1,88 (m, 2H), 1,87-1,77 (m, 2H), 1,41-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-104	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,84 (d, J=2,6, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 7,33 (d, J= 8,5, 1H), 7,19 (dd, J1= 8,5, J2=2,6, 1H), 6,69 (d, J= 9,0, 1H), 6,10 (s, 1H), 4,58-4,49 (m, 1H), 4,02 (t, J= 7,1, 2H), 3,98-3,88 (m, 2H) , 3,71-3,61 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,99-1,89 (m, 2H), 1,88-1,79 (m, 2H), 1,41-1,30 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)

Tabla 36

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-105	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,36 (d, J=8,0, 2H), 7,21 (seudo-t, J=8,0, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,60 (s, 1H), 4,54-4,46 (m, 1H), 4,05 (t, J=7,0, 2H), 4,01-3,90 (m, 2H), 3,69-3,58 (m, 2H), 2,16- 2,05 (m, 2H), 2,01- 1,90 (m, 2H), 1,89-1,75 (m, 2H), 1,39-1,27 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-106	114,9-116,1	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,84 (d, J=2,0, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,58

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		(dd, J1=8,4, J2=2,0, 1H), 7,43 (d, J=8,4, 1H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,56-4,46 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,99-3,90 (m, 2H), 3,70-3,60 (m, 2H), 2,15-2,06 (m, 2H), 2,00-1,89 (m, 2H), 1,86-1,75 (m, 2H), 1,40-1,24 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-107	161,8-162,4	δ 8,41 (seudo-d, J=2,2, 1H), 7,68-7,61 (m, 3H), 7,26 (s, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,83 (s, 1H), 4,55-4,46 (m, 1H), 4,01-3,92 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,68-3,58 (m, 2H), 2,16-2,06 (m, 2H), 1,99-1,88 (m, 2H)
1a-108	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,63 (seudo-d, J1=1,9, 2H), 7,25 (t, J=1,9, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,82 (s, 1H), 4,55-4,47 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,99-3,89 (m, 2H), 3,70-3,59 (m, 2H), 2,16-2,05 (m, 2H), 2,00-1,88 (m, 2H), 1,87-1,74 (m, 2H), 1,39-1,27 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-126	Líquido viscoso	δ 8,4 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,36 (s, 1H), 4,46-4,38 (m, 1H), 3,95-3,83 (m, 4H), 3,70-3,60 (m, 2H), 2,10-2,00 (m, 2H), 1,96-1,84 (m, 2H), 1,77-1,67 (m, 2H), 1,36-1,28 (m, 2H), 1,27 (s, 9H), 0,91 (t, J=7,4, 3H)
1a-127	Líquido viscoso	δ 8,43 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,66 (d, J=9,5, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,55-4,45 (m, 1H), 4,01-3,89 (m, 4H), 3,74-3,64 (m, 2H), 2,12-2,02 (m, 2H), 1,99-1,89 (m, 2H), 1,84-1,74 (m, 2H), 1,36-1,25 (m, 2H), 0,92 (t, J=7,4, 3H)

Tabla 37

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-145	Líquido viscoso	δ 9,05 (seudo-d, J=2,8, 1H), 8,24 (dd, J1=9,5, J2=2,8, 1H), 6,64 (d, J=9,5, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,58-4,48 (m, 1H), 4,05-3,93 (m, 4H), 3,86-3,74 (m, 2H), 2,17-2,06 (m, 2H), 2,02-1,91 (m, 2H), 1,84-1,73 (m, 2H), 1,36-1,26 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-173	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,99-7,93 (m, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,62-7,57 (m, 2H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,68-4,59 (m, 1H), 3,87-3,77 (m, 2H), 3,76-3,66 (m, 2H), 2,17-2,06 (m, 2H), 2,03-1,92 (m, 2H)
1a-174	144,2-145,5	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,47 (d, J=8,0, 1H), 7,32 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,16 (d, J=7,6, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,61-4,55 (m, 1H), 3,83-3,76 (m, 2H), 3,72-3,65 (m, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H)
1a-200	130,8-131,1	δ 8,58 (seudo-d, J=4,9, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,83 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,65 (d, J=8,2, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,30 (dd, J1=7,3, J2=4,9, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,24-4,12 (m, 3H), 3,38-3,30 (m, 1H), 3,06-2,99 (m, 1H), 2,30-2,23 (m, 1H), 2,11-2,03 (m, 1H), 1,84-1,74 (m, 1H), 1,11 (d, J=6,7, 3H)
1a-201	Líquido viscoso	δ 8,57 (dd, J1=4,8, J2=1,1, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,85 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,70 (d, J=8,2, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,33-7,28 (m, 1H), 6,66 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,58-4,52 (m, 1H), 4,10-4,05 (m, 1H), 4,04-3,99 (m, 1H), 3,45-3,37 (m, 1H), 3,25-3,18 (m, 1H), 2,24-2,16 (m, 1H), 2,14-2,04 (m, 1H), 1,91-1,82 (m, 1H), 1,13 (d, J=6,6, 3H)

Tabla 38

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-202	Líquido viscoso	δ 8,58-8,56 (m, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,85 (dt, J1=7,8, J2=1,7, 1H), 7,69 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 7,33-7,28 (m, 1H), 6,66 (d, J=9,0, 1H), 5,99 (s, 1H), 4,69-4,64 (m, 1H), 4,19 (seudo-d, J=13,7, 1H), 4,10 (seudo-d, J=13,7, 1H), 3,33 (seudo-t, J=13,1, 1H), 3,15 (dd, J1=13,1, J2=11,1, 1H), 2,26-2,18 (m, 1H), 1,87-1,74 (m, 2H), 1,53-1,38 (m, 2H), 0,97 (t, J=7,5, 3H)
1a-203	Líquido viscoso	δ 8,59-8,56 (m, 1H), 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,83 (dt, J1=7,8, J2=1,9, 1H), 7,66 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,61 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,32-7,28 (m, 1H), 6,65 (d, J=9,0, 1H), 5,99 (s, 1H), 4,34-4,28 (m, 1H), 4,09 (dd, J1=13,7, J2=3,5, 1H), 4,01-3,94 (m, 1H), 3,55-3,48 (m, 1H), 3,31 (dd, J1=13,7, J2=7,7, 1H), 2,23-2,15 (m, 1H), 1,93-1,80 (m, 2H), 1,69-1,60 (m, 1H), 1,41-1,31 (m, 1H), 1,01 (t, J=7,5, 3H)
1a-204	Líquido viscoso	δ 8,58-8,56 (m, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,85 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,69 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,62 (dd, J1=9,1, J2=2,5, 1H), 7,33-7,28 (m, 1H), 6,65 (d, J=9,1, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,64-4,60 (m, 1H), 4,17 (dd, J1=13,6, J2=3,8, 1H), 4,09 (seudo-d, J=13,6, 1H), 3,33 (seudo-t, J=13,2, 1H), 3,15 (dd, J1=13,2, J2=11,0, 1H), 2,24-2,16 (m, 1H), 1,92-1,78 (m, 2H), 1,47-1,31 (m, 4H), 0,90 (t, J=6,7, 3H)

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-205	104,2-101,7	δ 8,60-8,57 (m, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,83 (ddd, J1=8,2, J2=7,4, J3=1,9, 1H), 7,73 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,54-7,47 (m, 2H), 7,29-7,24 (m, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 6,01 (s, 1H), 4,70-4,65 (m, 1H), 3,89-3,81 (m, 2H), 3,78-3,70 (m, 2H), 2,13-1,99 (m, 4H)

Tabla 39

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-206	114,2-115,0	δ 8,60-8,57 (m, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,83 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,75 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,44-7,38 (m, 2H), 7,28-7,23 (m, 1H), 6,78 (seudo-t, J=8,8, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,72-4,65 (m, 1H), 3,90-3,81 (m, 2H), 3,78-3,69 (m, 2H), 2,14-1,98 (m, 4H)
1a-207	Líquido viscoso	δ 8,59-8,57 (m, 1H), 8,39 (seudo-s, 1H), 7,84 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,75 (d, J=8,0, 1H), 7,61 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,44-7,37 (m, 2H), 7,28-7,23 (m, 1H), 6,78 (seudo-t, J=8,8, 1H), 6,66 (d, J=9,0, 1H), 6,03 (s, 1H), 4,62-4,57 (m, 1H), 4,11-3,97 (m, 2H), 3,46-3,38 (m, 1H), 3,29-3,22 (m, 1H), 2,27-2,20 (m, 1H), 2,15-2,04 (m, 1H), 1,92-1,82 (m, 1H), 1,09 (d, J=6,9, 3H)
1a-208	125,0-125,6	δ 8,61-8,58 (m, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,82 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,71 (seudo-d, J=8,2, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 7,44-7,38 (m, 2H), 7,29-7,23 (m, 1H), 6,78 (seudo-t, J=8,9, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 6,03 (s, 1H), 4,24-4,15 (m, 3H), 3,41-3,32 (m, 1H), 3,09-3,02 (m, 1H), 2,33-2,26 (m, 1H), 2,16-2,04 (m, 1H), 1,87-1,77 (m, 1H), 1,13 (d, J=6,6, 3H)
1a-209	Líquido viscoso	δ 8,53 (dd, J1=4,7, J2=1,6, 1H), 8,37 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,92 (dd, J1=8,1, J2=1,1, 1H), 7,61 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,43 (dd, J1=8,1, J2=4,7, 1H), 6,64 (d, J=9,0, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,61-4,55 (m, 1H), 3,79-3,71 (m, 2H), 3,64-3,56 (m, 2H), 2,09-2,00 (m, 2H), 1,92-1,83 (m, 2H)
1a-210	152,5-152,9	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,72 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,46 (d, J=8,0, 1H), 7,16 (d, J=7,6, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,70-4,62 (m, 1H), 3,83-3,76 (m, 4H), 2,57 (s, 3H), 2,06-1,96 (m, 4H)

Tabla 40

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-211	100,2-100,4	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,63 (s, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,79-4,73 (m, 1H), 3,95-3,88 (m, 2H), 3,86-3,78 (m, 2H), 2,11-2,04 (m, 4H)
1a-212	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,1, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,56-4,52 (m, 1H), 4,23-4,17 (m, 1H), 4,17-4,11 (m, 1H), 4,02 (t, J=7,2, 2H), 3,33-3,25 (m, 1H), 3,25-3,15 (m, 1H), 2,21-2,14 (m, 1H), 1,87-1,76 (m, 4H), 1,56-1,41 (m, 2H), 1,38-1,24 (m, 2H), 0,99 (t, J=7,5, 3H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-213	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,77 (s, 1H), 4,24-4,19 (m, 1H), 4,18-4,08 (m, 2H), 3,99 (t, J=7,2, 2H), 3,42-3,34 (m, 1H), 3,18-3,11 (m, 1H), 2,22-2,15 (m, 1H), 1,89-1,62 (m, 5H), 1,41-1,24 (m, 3H), 1,04 (t, J=7,5, 3H), 0,92 (t, J=7,4, 3H)
1a-214	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,1, 1H), 5,77 (s, 1H), 4,53-4,47 (m, 1H), 4,22-4,11 (m, 2H), 4,03 (t, J=7,2, 2H), 3,33-3,24 (m, 1H), 3,22-3,14 (m, 1H), 2,21-2,13 (m, 1H), 1,95-1,86 (m, 1H), 1,85-1,76 (m, 3H), 1,49-1,24 (m, 6H), 0,93 (t, J=7,4, 3H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-215	102,5-103,0	δ 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,05-3,94 (m, 2H), 3,78 (seudo-d, J=13,5, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,56-3,48 (m, 1H), 3,28 (d, J=13,5, 1H), 2,12-2,04 (m, 1H), 1,94-1,85 (m, 1H), 1,10 (s, 3H), 1,08 (s, 3H)

Tabla 41

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-216	Líquido viscoso	δ 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J=9,1, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,05-3,94 (m, 2H), 4,01 (t, J=7,2, 2H), 3,77 (seudo-d, J=13,5, 1H),

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		3,55-3,48 (m, 1H), 3,28 (d, J=13,5, 1H), 2,11-2,04 (m, 1 H), 1,93- 1,85 (m, 1H), 1,84-1,75 (m, 2H), 1,36-1,25 (m, 2H), 1,10 (s, 3H), 1,08 (s, 3H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-217	127,9-128,3	δ 8,39 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,65 (s, 1H), 6,64 (d, J=9,0, 1H), 4,35-4,29 (m, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,23-3,15 (m, 1H), 3,14-3,06 (m, 2H), 2,05-1,99 (m, 2H), 1,68-1,58 (m, 2H)
1a-218	105,3-105,6	δ 8,40 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,66 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,06 (s, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 4,61 (seu do-d, J=13,8, 2H), 4,47 (t, J= 7,5, 2H), 3,30-3,20 (m, 1H), 2,99-2,89 (m, 2H), 2,14-2,08 (m, 2H), 1,99-1,91 (m, 2H), 1,88-1,75 (m, 2H), 1,44-1,33 (m, 2H), 0,97 (t, J=7,4, 3H)
1a-219	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 4,40-4,32 (m, 1H), 4,23-4,16 (m, 2H), 3,71 (s, 3H), 3, 40-3,32 (m, 2H), 2,13-2,05 (m, 2H), 2,07 (s, 3H), 1,89-1,79 (m, 2H)
1a-220	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,65 (d d, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 4,72-4,64 (m, 1H), 4,57 (d, J=5,9, 2H), 4,20-4,14 (m, 2H), 3,73 (s, 3H), 3,43-3, 35 (m, 2H), 2,17-2,09 (m, 2H), 1,91-1,81 (m, 2H), 1,59 (t, J=5,9, 1H)
1a-221	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (d d, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 4,39-4,31 (m, 1H), 4,21-4,14 (m, 2H), 3,96 (t, J=7,4, 2H), 3,40-3,32 (m, 2H), 2,12-2,05 (m, 2H), 2,07 (s, 3H), 1,88-1,74 (m, 4 H), 1,36-1,27 (m, 2H), 0,92 (t, J= 7,4, 3H)

Tabla 42

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-222	Líquido viscoso	δ 9,84 (d, J= 1,0, 1H), 8,40 (s eudo-d, J=2,3, 1H), 7,64 (d d, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,08-5,01 (m, 1H), 4,34-4,29 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 3,22-3,14 (m, 1H), 2,91 (dd, J1= 13,7, J2=10,3, 1H), 2, 12-2,05 (m, 1H), 2,04-1,94 (m, 1H), 1,69-1,61 (m, 1H), 1,15 (d, J=6,6, 3H)
1a-223	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 8,18 (s, 2H), 7,76(s, 1H), 7,65 (dd, J1= 9,0, J2=2,4, 1H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,93 (s, 1H), 4,59-4,51 (m, 1H), 4,03 (t, J=7,1, 2H), 4,01-3,91 (m, 2H), 3,71-3,61 (m, 2H), 2,18-2,07 (m, 2H), 2, 01-1,91 (m, 2H), 1,89-1,79 (m, 2H), 1,42-1,30 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-224	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J= 2,4, 1H), 7,65 (dd, J 1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,30-7,22 (m, 2H), 6,74-6,68 (m, 2H), 5,81 (s, 1H), 4,55-4,48 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,1, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,69-3,61 (m, 2H), 2,15-2,07 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,85- 1,76 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-225	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J= 2,5, 1H), 7,64 (dd, J 1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,29-7,23 (m, 2H), 6,75-6,69 (m, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,49-4,43 (m, 1H), 4,09-4,02 (m, 2H), 4,03 (t, J= 7,1, 2H), 3,45-3,36 (m, 1H), 3,31- 3,24 (m, 1H), 2,23-2,16 (m, 1H), 2,16-2,08 (m, 1H), 1,92-1,79 (m, 3H), 1,42-1,32 (m, 2H), 1,11 (d, J=6,9, 3H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-226	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J= 2,4, 1H), 7,64 (dd, J 1=9,1, J2=2,4, 1H), 7,30-7,25 (m, 2H), 6,75-6,68 (m, 1H), 6,70 (d, J=9,1, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,32-4,26 (m, 2H), 4,06-4,00 (m, 1H), 3,98 (t, J= 7,2, 2H), 3,30-3,22 (m, 1H), 2,99- 2,92 (m, 1H), 2,32-2,24 (m, 1H), 2,00-1,99 (m, 1H), 1,84- 1,67 (m, 3H), 1,38-1,27 (m, 2H), 1,14 (d, J=6,6, 3H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)

Tabla 43

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-227	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J=2,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,30-7,24 (m, 2H), 6,74-6,67 (m, 2H), 5,80 (s, 1H), 4,59-4,55 (m, 1H), 4,24-4,10 (m, 2H), 4, 07-3,97 (m, 2H), 3,36- 3,27 (m, 1 H), 3,25-3,15 (m, 1H), 2,26-2,19 (m, 1H), 1,89- 1,65 (m, 4H), 1,60-1,28 (m, 4H), 1,07-0,91 (m, 6H)
1a-228	Líquido viscoso	δ 8,40 (seu do-d, J=2,2, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,2, 1H), 7,30-7,23 (m, 2H), 6,71 (seudo-t, J=8,9, 1H), 6,68 (d, J= 9,0, 1H), 5,79 (s, 1 H), 4,24-4,10 (m, 3H), 3,98 (t, J= 7,1, 2H), 3,45-3,37 (m, 1H), 3,18 (dd, J1=13,6, J2=8,6, 1H), 2,25-2,19 (m, 1H), 1,90-1,67 (m, 5H), 1, 43-1,24 (m, 3H), 1,05 (t, J= 7,5, 3H), 0,93 (t, J= 7,4, 3H)
1a-229	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J= 2,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,30-7,23 (m, 2H), 6,74-6,66 (m, 2H), 5,79 (s, 1H), 4,56-4,51 (m, 1H), 4,24-4,08 (m, 2H), 4, 05-3,96

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		(m, 2H), 3,46-3,27 (m, 1H), 3,24-3,11 (m, 1H), 2,27-2,18 (m, 1H), 1,98-1,89 (m, 1H), 1,88-1,70 (m, 3H), 1,58-1,30 (m, 6H), 0,98 (m, 6H)
1a-230	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,29-7,24 (m, 2H), 6,74-6,67 (m, 2H), 5,81 (s, 1H), 4,54-4,49 (m, 1H), 3,99 (t, J=7,2, 2H), 3,96-3,89 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,85-1,78 (m, 2H), 1,35-1,25 (m, 6H), 0,86 (seudo-t, J=7,0, 3H)
1a-231	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,29-7,23 (m, 2H), 6,75-6,68 (m, 2H), 5,79 (s, 1H), 4,47-4,45 (m, 1H), 4,12-4,04 (m, 2H), 4,01 (t, J=7,2, 2H), 3,44-3,36 (m, 1H), 3,31-3,22 (m, 1H), 2,23-2,17 (m, 1H), 2,16-2,10 (m, 1H), 1,91-1,80 (m, 3H), 1,38-1,24 (m, 6H), 1,11 (d, J=6,8, 3H), 0,86 (t, J=7,0, 3H)

Tabla 44

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-232	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,61 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,30-7,25 (m, 2H), 6,74-6,68 (m, 2H), 5,80 (s, 1H), 4,32-4,26 (m, 2H), 4,06-3,99 (m, 1H), 3,97 (t, J=7,2, 2H), 3,30-3,22 (m, 1H), 2,98-2,92 (m, 1H), 2,31-2,24 (m, 1H), 2,07-2,00 (m, 1H), 1,84-1,67 (m, 3H), 1,34-1,23 (m, 6H), 1,14 (d, J=6,6, 3H), 0,86 (t, J=6,9, 3H)
1a-233	75,0-75,6	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,39-7,25 (m, 2H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,76 (s, 1H), 4,53-4,48 (m, 1H), 3,99 (t, J=7,1, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,69-3,61 (m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H), 1,98-1,89 (m, 2H), 1,84-1,76 (m, 2H), 1,39-1,29 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-234	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,40-7,31 (m, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,75 (s, 1H), 4,32-4,25 (m, 2H), 4,06-3,99 (m, 1H), 3,97 (t, J=7,2, 2H), 3,30-3,22 (m, 1H), 2,98-2,91 (m, 1H), 2,30-2,25 (m, 1H), 2,08-2,00 (m, 1H), 1,84-1,67 (m, 3H), 1,38-1,28 (m, 2H), 1,14 (d, J=6,6, 3H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-235	99,2-100,7	δ 8,41 (s, 1H), 7,88 (seudo-d, J=6,7, 2H), 7,67-7,63 (m, 3H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,89 (s, 1H), 4,56-4,50 (m, 1H), 4,02 (t, J=7,1, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,16-2,07 (m, 2H), 2,00-1,90 (m, 2H), 1,87-1,77 (m, 2H), 1,40-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-236	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,74-7,69 (m, 2H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,06 (seudo-t, J=8,8, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,55-4,48 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,97-3,89 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,85-1,77 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)

Tabla 45

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-237	133,1-134,0	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,67 (seudo-d, J=8,5, 2H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,39 (seudo-d, J=8,5, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,55-4,49 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,1, 2H), 3,97-3,88 (m, 2H), 3,71-3,62 (m, 2H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,99-1,89 (m, 2H), 1,85-1,76 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 1,33 (s, 9H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-238	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,67 (seudo-d, J=8,5, 2H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,26 (seudo-d, J=8,5, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,55-4,48 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,96-3,88 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,13-2,04 (m, 2H), 1,98-1,90 (m, 2H), 1,85-1,76 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-239	86,2-86,5	δ 8,42 (seudo-d, J=2,3, 1H), 8,23 (d, J=9,0, 2H), 7,91 (d, J=9,0, 2H), 7,66 (dd, J1=9,0, J2=2,3, 1H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,94 (s, 1H), 4,57-4,52 (m, 1H), 4,03 (t, J=7,1, 2H), 3,99-3,91 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,17-2,08 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,88-1,79 (m, 2H), 1,41-1,31 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-240	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,86 (d, J=8,0, 2H), 7,65 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 7,62 (d, J=8,0, 2H), 6,71 (d, J=9,1, 1H), 5,88 (s, 1H), 4,56-4,51 (m, 1H), 4,02 (t, J=7,1, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,70-3,63 (m, 2H), 2,16-2,07 (m, 2H), 2,00-1,91 (m, 2H), 1,87-1,78 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-241	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,68 (seudo-d, J=8,9, 2H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,91 (seudo-d, J=8,9, 2H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,77 (s, 1H), 4,55-4,47 (m, 1H), 3,99 (t, J=7,2, 2H), 3,96-3,88 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,69-3,62 (m, 2H), 2,13-2,05 (m, 2H), 1,98-1,90 (m, 2H), 1,85-1,76 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)

ES 2 382 481 T3

Tabla 46

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-242	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,76 (seudo-d, J=8,8, 2H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,22 (seudo-d, J=8,8, 2H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,82 (s, 1H), 4,5-4,49 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,1, 2H), 3,99-3,90 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,15-2,06 (m, 2H), 1,98-1,91 (m, 2H), 1,85-1,76 (m, 2H), 1,39-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-243	98,7-99,8	δ 8,35 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,58 (dd, J=9,0, J2=2,5, 1H), 6,60 (d, J=9,0, 1H), 4,50-4,34 (m, 4H), 3,40 (s, 3H), 2,88-2,73 (m, 2H), 2,37-2,28 (m, 1H), 1,79-1,72 (m, 2H), 1,58-1,48 (m, 2H), 1,45 (s, 3H), 1,39 (t, J=7,1, 3H)
1a-244	Líquido viscoso	δ 8,40 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 4,91-4,85 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,3, 2H), 3,88-3,81 (m, 2H), 3,37-3,29 (m, 2H), 2,22-2,14 (m, 2H), 2,05-1,94 (m, 2H), 1,84-1,75 (m, 2H), 1,38-1,28 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-245	133,8-134,5	δ 10,04 (br-s, 1H), 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,93 (s, 1H), 4,67-4,58 (m, 1H), 4,00-3,92 (m, 2H), 3,64-3,56 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,95-1,85 (m, 2H)
1a-246	136,9-137,6	δ 10,00 (br-s, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,92 (s, 1H), 4,31-4,23 (m, 2H), 4,15 (br-s, 1H), 3,27-3,18 (m, 1H), 2,94-2,87 (m, 1H), 2,30-2,22 (m, 1H), 2,03-1,94 (m, 1H), 1,75-1,66 (m, 1H), 1,10 (d, J=6,8, 3H)
1a-247	120,0-120,8	δ 8,39 (seudo-s, 2H), 7,66-7,60 (m, 2H), 7,55 (d, J=8,2, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,67-4,59 (m, 1H), 3,86-3,78 (m, 2H), 3,75-3,66 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,11-2,01 (m, 2H), 2,00-1,92 (m, 2H)

Tabla 47

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-248	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J=2,5, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,37 (s, 2H), 6,93 (s, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,82 (s, 1H), 4,55-4,49 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,98-3,89 (m, 2H), 3,70-3,61 (m, 2H), 2,34 (s, 6H), 2,15-2,05 (m, 2H), 2,20-1,90 (m, 2H), 1,86-1,76 (m, 2H), 1,38-1,29 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-249	95,1-95,7	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,66 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,60 (s, 2H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,90 (s, 1H), 4,55-4,49 (m, 1H), 4,01 (t, J=7,1, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,68-3,61 (m, 2H), 2,18-2,08 (m, 2H), 1,98-1,89 (m, 2H), 1,85-1,77 (m, 2H), 1,39-1,29 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-250	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,83 (s, 1H), 4,61-4,53 (m, 1H), 3,90-3,75 (m, 4H), 2,08-1,98 (m, 4H), 1,47 (s, 9H)
1a-251	Líquido viscoso	δ 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,67 (seudo-d, J=8,8, 2H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 7,44 (seudo-t, J=7,8, 2H), 7,34 (seudo-t, J=7,4, 1H), 6,66 (d, J=9,2, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,24-4,16 (m, 2H), 4,13-4,07 (m, 1H), 3,32-3,25 (m, 1H), 3,00-2,94 (m, 1H), 2,30-2,23 (m, 1H), 2,09-1,98 (m, 1H), 1,78-1,68 (m, 1H), 1,10 (d, J=6,7, 3H)
1a-252	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,44 (seudo-d, J=8,0, 1H), 7,30 (seudo-t, J=7,8, 1H), 7,15 (seudo-d, J=7,6, 1H), 6,66 (d, J=9,2, 1H), 5,96 (s, 1H), 4,20-4,12 (m, 2H), 4,12-4,05 (m, 1H), 3,32-3,24 (m, 1H), 3,01-2,94 (m, 1H), 2,39 (s, 3H), 2,29-2,22 (m, 1H), 2,06-1,99 (m, 1H), 1,78-1,67 (m, 1H), 1,10 (d, J=6,6, 3H)

Tabla 48

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-253	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,67-7,63 (m, 2H), 7,22 (d, J=8,0, 1H), 6,71 (d, J=9,0, 1H), 5,87 (s, 1H), 4,56-4,50 (m, 1H), 4,01 (t, J=7,2, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,69-3,62 (m, 2H), 2,16-2,08 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,85-1,78 (m, 2H), 1,40-1,30 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-254	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,52 (seudo-d, J=8,0, 1H), 7,46 (seudo-d, J=10,0, 1H), 7,36-7,29 (m, 1H), 7,00-6,94 (m, 1H), 6,70 (d, J=9,0, 1H), 5,83 (s, 1H), 4,55-4,49 (m, 1H), 4,00 (t, J=7,2, 2H), 3,97-3,90 (m, 2H), 3,69-3,62 (m, 2H), 2,15-2,06 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,86-1,77 (m, 2H), 1,40-1,30 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-255	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,66-7,62 (m, 3H), 7,78 (seudo-d, J=8,0, 2H), 6,70

ES 2 382 481 T3

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		(d, J=8,8, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,55-4,48 (m, 1H), 4,00 (t, J= 7,2, 2H), 3,96-3,89 (m, 2H), 3,70-3,62 (m, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,99-1,90 (m, 2H), 1,85-1,77 (m, 2H), 1,40-1,30 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-256	Líquido viscoso	δ 8,59 (seudo-d, J=5,6, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,86-7,91 (m, 1H), 7,78 (d, J=1,6, 2H), 7,75 (d, J= 8,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 7,32 (t, J=2,0, 1H), 7,29-7,24 (m, 1H), 6,68 (d, J=9,2, 1H), 6,07 (s, 1H), 4,70-4,66 (m, 1H), 3,90-3,83 (m, 2H), 3,76-3,69 (m, 2H), 2,13-1,99 (m, 4H)
1a-257	Líquido viscoso	δ 8,60(seudo-d, J=4,8, 1H), 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,82 (seudo-t, J=8,4, 1H), 7,79 (d, J= 2,0, 2H), 7,70 (d, J= 8,0, 1H), 7,63 (dd, J1= 9,1, J2=2,6, 1H), 7,32 (t, J=2,0, 1H), 7,28-7,24 (m, 1H), 6,68 (d, J= 9,1, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,24 -4,15 (m, 3H), 3,40-3,32 (m, 1H), 3,08-3,00 (m, 1H), 2,34-2,26 (m, 1H), 2,14-2,04 (m, 1H), 1,86-1,76 (m, 1H), 1,13 (d, J=6,7, 3H)

Tabla 49

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-258	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,69 (d, J= 8,4, 2H), 7,64 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 7,49 (d, J=8,4, 2H), 6,70 (d, J=8,8, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,54-4,48 (m, 1H), 3,99 (t, J=7,2, 2H), 3,97-3,89 (m, 2H), 3,69-3,62 (m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H), 1,98-1,89 (m, 2H), 1,85-1,76 (m, 2H), 1,40-1,29 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1a-259	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,8, 1H), 7,78 (d, J= 2,0, 1H), 7,30-7,23 (m, 2H), 6,74-7,67 (m, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,53-4,46 (m, 1H), 4,01 (t, J=7,2, 2H), 3,78-3,70 (m, 2H), 3,51-3,44 (m, 2H), 2,23-2,15 (m, 2H), 2,08-1,99 (m, 2H), 1,86-1,78 (m, 2H), 1,41-1,31 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-260	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 7,61 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,2, 1H), 6,65 (d, J=9,2, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,80-4,72 (m, 1H), 4,62-4,65 (m, 2H), 4,37-4,29 (m, 1H), 3,97-3,90 (m, 2H), 3,60-3,52 (m, 2H), 3,10-3,02 (m, 2H), 2,28-2,16 (m, 2H), 2,09-2,00 (m, 4H), 1,90-1,80 (m, 2H)
1a-261	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,65 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,70 (d, J= 9,1, 1H), 5,85 (s, 1H), 5,32 (s, 2H), 4,56-4,51 (m, 1H), 3,98-3,91 (m, 2H), 3,67-3,60 (m, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,13-2,07 (m, 2H), 1,97-1,91 (m, 2H)
1a-262	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 8,8, 1H), 5,84 (s, 1H), 5,36 (s, 2H), 4,56-4,50 (m, 1H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,68-3,61 (m, 2H), 3,61 (q, J=7,0, 2H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,98-1,91 (m, 2H), 1,17 (t, J=7,0, 3H)
1a-263	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 9,2, 1H), 5,83 (s, 1H), 5,35 (s, 2H), 4,31-4,26 (m, 2H), 4,07-4,00 (m, 1H), 3,59 (q, J=7,0, 2H), 3,28-3,20 (m, 1H), 2,97-2,90 (m, 1H), 2,28-2,07 (m, 1H), 2,09-2,01 (m, 1H), 1,79-1,69 (m, 1H), 1,16 (t, J=7,0, 3H), 1,12 (d, J=6,4, 3H)

Tabla 50

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-264	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,2, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,53-4,48 (m, 1H), 4,18 (t, J=5,6, 2H), 3,97-3,90 (m, 2H), 3,74 (t, J=5,6, 2H), 3,69-3,62 (m, 2H), 3,30 (s, 3H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,97-1,88 (m, 2H)
1a-265	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,51-4,47 (m, 1H), 4,18 (t, J=5,9, 2H), 3,97-3,90 (m, 2H), 3,77 (t, J=5,9, 2H), 3,68-3,61 (m, 2H), 3,45 (q, J= 7,0, 2H), 2,11-2,03 (m, 2H), 1,97-1,88 (m, 2H), 1,12 (t, J=7,0, 3H)
1a-266	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 9,2, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,77 (t, J= 5,7, 1H), 4,52-4,48 (m, 1H), 4,11 (d, J=5,7, 2H), 3,97-3,90 (m, 2H), 3,68-3,61 (m, 2H), 3,35 (s, 6H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,97-1,88 (m, 2H)
1a-267	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 9,1, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,76 (t, J=5,7, 1H), 4,30-4,25 (m, 2H), 4,10 (d, J=5,7, 2H), 4,04-3,98 (m, 1H), 3,35 (s, 3H), 3,35 (s, 3H), 3,27-3,20 (m, 1H), 2,96-2,90 (m, 1H), 2,27-2,19 (m, 1H), 2,07-1,98 (m, 1H), 1,77-1,67 (m, 1H), 1,12 (d, J=6,8, 3H)
1a-268	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,2, 1H), 7,63 (dd, J1=8,9, J2=2,2, 1H), 6,68 (d, J= 8,9, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,77 (t, J= 5,6, 1H), 4,46-4,41 (m, 1H), 4,13 (seudo-d, J=5,6, 2H), 4,10-4,01 (m, 2H), 3,46-3,37 (m, 1H), 3,38 (s, 3H), 3,36 (s, 3H), 3,30-3,23 (m, 1H),

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		2,18-2,04 (m, 2H), 1,89-1,79 (m, 1H), 1,09 (d, J=6,8, 3H)

Tabla 51

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-269	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,64 (dd, J1=8,9, J2=2,6, 1H), 6,69 (d, J= 8,9, 1H), 5,80 (s, 1 H), 4,89 (t, J= 5,7, 1H), 4,53-4,46 (m, 1H), 4, 11 (seud-o-d, J 5,7, 2H), 3,96-3,89 (m, 2H), 3,76-3,61 (m, 4H), 3,49-3,41 (m, 2H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,97-1,88 (m, 2H), 1,12 (t, J=7,2, 6H)
1a-270	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,64 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,68 (d, J= 9,1, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,88 (t, J= 5,7, 1H), 4,29-4,24 (m, 2H), 4,0 9 (seudo-d, J=5,7, 2H), 4,06-3,97 (m, 1H), 3,75-3,66 (m, 2H), 3,48-3,40 (m, 2H), 3,27-3,19 (m, 1H), 2,97-2,90 (m, 1H), 2,25-2,17 (m, 1H), 2,05-1,98 (m, 1H), 1,77-1,67 (m, 1H), 1,14-1,09 (m, 9H)
1a-271	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,65 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,70 (d, J= 9,1, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,52-4,45 (m, 1H), 4,37 (t, J=5,6, 1H), 4,08 (t, J=7,2, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,65-3,58 (m, 2H), 3,31 (s, 6H), 2,14-2,04 (m, 4H), 1,96-1,87 (m, 2H)
1a-272	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 8,8, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,52-4,46 (m, 2H), 4,14-4,08 (m, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,67-3,58 (m, 4H), 3,51-3,43 (m, 2H), 2,15-2,04 (m, 4H), 1,96-1,87 (m, 2H), 1,17 (t, J=7,0, 6H)
1a-273	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (d d, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,2, 1H), 5,82 (s, 1H), 5,28 (t, J=4,4, 1H), 4,54-4,48 (m, 1H), 4,16 (d, J=4,4, 2H), 3,96-3,85 (m, 6H), 3,70-3,63 (m, 2H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,98-1,89 (m, 2H)
1a-274	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,80 (s, 1H), 5,27 (t, J=4,4, 1H), 4,31-4,28 (m, 2H), 4,14 (d, J=4,4, 2H), 4,05-3,99 (m, 1H), 3,95-3,85 (m, 4H), 3,29-3,21 (m, 1H), 2,98-2,91 (m, 1H), 2,28-2,20 (m, 1H), 2,07-1,99 (m, 1H), 1,78-1,67 (m, 1H), 1,12 (d, J=6,4, 3H)

Tabla 52

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-275	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 5,28 (t, J= 4,4, 1H), 4,48-4,43 (m, 1H), 4,19 (d, J=4,4, 2H), 4,13-4,02 (m, 2H), 3,96-3,85 (m, 4H), 3,47-3,39 (m, 1H), 3,30- 3,23 (m, 1H), 2,21-2,07 (m, 2H), 1,90-1,80 (m, 1H), 1,10 (d, J=6,8, 3H)
1a-276	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (d d, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,70(d, J= 8,8, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,53-4,47 (m, 1H), 4,34-4,27 (m, 1H), 4,14-4,09 (m, 1H), 4,01-3,8 9 (m, 3H), 3,85-3,79 (m, 1H), 3,78-3,71 (m, 1H), 3,69- 3,60 (m, 2H), 2,12-2,05 (m, 2H), 2,04-1,84 (m, 5H), 1,75-1,66 (m, 1H)
1a-277	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (d d, J1=9,1, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,1, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,91 (t, J=4,5, 1H), 4,52-4,46 (m, 1H), 4,16 (t, J= 7,3, 2H), 3,97-3,90 (m, 4H), 3,85-3,81 (m, 2H), 3,68-3,61 (m, 2H), 2,21- 2,15 (m, 2H), 2,12-2,05 (m, 2H), 1,97-1,88 (m, 2H)
1a-278	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,2, 1H), 7,65 (d d, J1=8,9, J2=2,2, 1H), 6,70 (d, J= 8,9, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,54 (t, J=5,0, 1H), 4,51-4,45 (m, 1H), 4,13 (t, J= 7,2, 2H), 4,09-4,04 (m, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,75-3,68 (m, 2H), 3,67- 3,59 (m, 2H), 2,21-2,03 (m, 5H), 1,96-1,87 (m, 2H), 1,32 (seudo-d, J=13,2, 1H)
1a-279	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (d d, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 9,2, 1H), 5,87 (s, 1H), 4,62-4,57 (m, 1H), 3,89-3,75 (m, 4H), 2,67 (s, 3H), 2,04-2,00 (m, 4H)
1a-280	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J 2,4, 1H), 7,63 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 9,0, 1H), 5,88 (s, 1H), 4,64-4,58 (m, 1 H), 3,89-3,77 (m, 4H), 3,11 (q, J=7,4, 2H), 2,10-1,97 (m, 4H), 1,24 (t, J=7,4, 3H)

Tabla 53

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-281	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (d d, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J= 9,2, 1H), 5,90 (s, 1H), 4,64-4,59 (m, 1H), 3,91-3,76 (m, 4H), 3,06 (seudo-t, J=7,3, 2H), 2,09-

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		1,99 (m, 4H), 1,83-1,72 (m, 2H), 1,02 (t, J=7,4, 3H)
1a-282	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,64 (d d, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,69 (d, J= 9,1, 1H), 5,87 (s, 1H), 4,62-4,57 (m, 1 H), 3,89-3,76 (m, 4H), 3,08 (t, J=7,5, 2H), 2,07-1,99 (m, 4H), 1,96-1,68 (m, 2H), 1,48-1,38 (m, 2H), 0,95 (t, J=7,4, 3H)
1a-283	99,8-100,1	δ 8,40 (s, 1H), 7,97 (seudo-d, J=8,4, 2H), 7,65-7,60 (m, 2 H), 7,52-7,47 (m, 2H), 6,68 (d, J=8,8, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,68-4,63 (m, 1H), 3,85-3,74 (m, 4H), 2,10-1,97 (m, 4H)
1a-284	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 7,51 (d d, J1=7,4, J2=2,0, 1H), 7,49-7,41 (m, 2 H), 7,39-7,34 (m, 1H), 6,66 (d, J=8,8, 1H), 5,90 (s, 1H), 4,64-4,59 (m, 1H), 3,79-3,71 (m, 2H), 3,67-3,59 (m, 2H), 2,05-1,95 (m, 2H), 1,94-1,86 (m, 2H)
1a-285	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,94 (t, J=2,0, 1H), 7,86 (seudo-d, J=8,0, 1H), 7,63 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 7,58 (seudo-d, J=8,1, 1H), 7,43 (seudo-t, J=8,0, 1H), 6,68 (d, J=9,2, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,69-4,63 (m, 1H), 3,82-3,78 (m, 4H), 2,10-1,96 (m, 4H)
1a-286	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,94 (seudo-d, J=8,8, 2H), 7,63 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 7,46 (seudo-d, J=8,8, 2H), 6,69 (d, J= 9,1, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,69-4,63 (m, 1H), 3,87-3,77 (m, 4H), 2,10-2,00 (m, 4H)
1a-287	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,89 (s, 1H), 4,67-4,61 (m, 1H), 4,06 (s, 3H), 3,87-3,79 (m, 4H), 2,09-2,00 (m, 4H)
1a-288	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,88 (s, 1H), 4,66-4,59 (m, 1 H), 4,52 (q, J=7,1, 2H), 3,88-3,79 (m, 4H), 2,11-1,98 (m, 4H), 1,45 (t, J=7,1, 3H)

Tabla 54

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-289	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,71 (d, J= 9,0, 1H), 5,90 (s, 1H), 4,67-4,61 (m, 1H), 4,41 (t, J=6,8, 2H), 3,91-3,76 (m, 4H), 2,13-1,97 (m, 4H), 1,89-1,79 (m, 2H), 1,01 (t, J=7,4, 3H)
1a-290	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,73 (d, J= 9,2, 1H), 5,93 (s, 1H), 4,69-4,64 (m, 1H), 4,45 (t, J=6,8, 2H), 3,92-3,77 (m, 4H), 2,16-1,97 (m, 4H), 1,83-1,74 (m, 2H), 1,50-1,39 (m, 2H), 0,94 (t, J=7,4, 3H)
1a-291	Líquido viscoso	δ 9,67 (s, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,2, 1H), 7,65 (dd, J1=8,9, J2=2,2, 1H), 6,69 (d, J=8,9, 1H), 5,90 (s, 1 H), 4,83 (seudo-s, 2H), 4,56-4,49 (m, 1H), 3,96- 3,88 (m, 2H), 3,63-3,54 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,92-1,83 (m, 2H)
1a-292	Líquido viscoso	δ 9,81 (s, 1H), 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,2, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,53-4,47 (m, 1H), 4,32 (t, J=6,7, 2H), 4,02-3,95 (m, 2H), 3,65-3,58 (m, 2H), 3,06 (seudo-t, J=6,7, 2H), 2,15-2,07 (m, 2H), 1,97-1,85 (m, 2H)
1a-293	136,5-136,9	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,65 (dd, J1=9,8, J2=2,4, 1H), 7,53 (s, 1H), 6,70 (d, J=8,8, 1H), 4,86-4,81 (m, 1H), 4,23-4,16 (m, 2H), 3,75 (s, 3H), 3,45-3,27 (m, 2H), 2,10-2,01 (m, 2H), 1,85-1,75 (m, 2H)
1a-294	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,65 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,71 (d, J=9,2, 1H), 4,97-4,91 (m, 1H), 4,25-4,18 (m, 2H), 4,18 (q, J=7,0, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,36-3,28 (m, 2H), 2,13-2,06 (m, 2H), 1,88-1,81 (m, 2H), 1,32 (t, J=7,0, 3H)
1a-295	148,1-148,4	δ 10,04 (br-s, 1H), 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,93 (s, 1H), 4,67-4,58 (m, 1H), 4,00-3,92 (m, 2H), 3,64-3,56 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,95-1,85 (m, 2H)

Tabla 55

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-296	136,9-137,6	δ 10,00 (br-s, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,92 (s, 1H), 4,31-4,23 (m, 2H), 4,15 (br-s, 1H), 3,27-3,18 (m, 1H), 2,94-2,87 (m, 1H), 2,30-2,22 (m, 1H), 2,03-1,94 (m, 1H), 1,75-1,66 (m, 1H), 1,10 (d, J=6,8, 3H)
1a-297	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1= 8,8, J2=2,4, 1H), 7,31-7,24 (m, 2H), 6,76-6,68 (m, 2H), 5,83 (s, 1 H), 4,82 (t, J=5,6, 1H), 4,57- 4,50 (m, 1H), 4,12 (d, J=5,6, 2H), 3,98-3,91 (m, 2H), 3,70-3,63 (m, 2H), 3,37 (s, 6H), 2,14-2,04 (m, 2H),

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		1,99-1,91 (m, 2H)
1a-298	Líquido viscoso	δ 8,4 0 (seu do-d, J= 2,2, 1H), 7,64 (dd, J1= 9,0, J2=2,2, 1H), 7,30-7,26 (m, 2H), 6,76-6,70 (m, 1H), 6,69 (d, J=9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,81 (t, J=5,6, 1H), 4,31-4,26 (m, 2H), 4,10 (d, J=5,6, 2H), 4,09-4,01 (m, 1H), 3,36 (s, 3H), 3,36(s, 3 H), 3,32-3,23 (m, 1H), 2,99-2,92 (m, 1H), 2,31-2,23 (m, 1H), 2, 10-2,00 (m, 1H), 1,79-1,6 9 (m, 1H), 1,14 (d, J=6,8, 3H)
1a-299	Líquido viscoso	δ 8,4 0 (seu do-d, J= 2,6, 1H), 7,63 (dd, J1= 9,0, J2= 2,6, 1H), 7,04-7,24 (m, 2H), 6,76-6,67 (m, 2H), 5,80 (s, 1 H), 4,82 (t, J=5,6, 1H), 4,49- 4,45 (m, 1H), 4,15-4,12 (m, 2H), 4,11-4,02 (m, 2H), 3,49-3,39 (m, 1H), 3,40 (s, 3H), 3,37 (s, 3H), 3,33-3,26 (m, 1H), 2,23-2,16 (m, 1H), 2,15-2,04 (m, 1H), 1,89-1,8 0 (m, 1H), 1,11 (d, J=6,8, 3H)
1a-300	Líquido viscoso	δ 8,4 1 (seu do-d, J= 2,4, 1H), 7,65 (dd, J1= 9,2, J2=2,4, 1H), 7,31-7,25 (m, 2H), 6,75-7,69 (m, 2H), 5,84 (s, 1 H), 5,32 (t, J=4,6, 1H), 4,58- 4,52 (m, 1H), 4,17 (d, J=1,6, 2H), 3,98-3,87 (m, 6H), 3,72-3,65 (m, 2H), 2,13-2,04 (m, 2H), 2,01-1,92 (m, 2H)

Tabla 56

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-301	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J=2,6, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,6, 1H), 7,32-7,26 (m, 2H), 6,75-6,68 (m, 2H), 5,82 (s, 1 H), 5,31 (t, J=4,6, 1H), 4,31-4,24 (m, 2H), 4,15 (d, J=4,6, 2H), 4,10-4,02 (m, 1H), 3,98-3,86 (m, 4H), 3,32-3,24 (m, 1H), 3,00-2,94 (m, 1H), 2,31-2,24 (m, 1H), 2,10-1,99 (m, 1H), 1,81-1,69 (m, 1H), 1,14 (d, J= 6,8, 3H)
1a-302	Líquido viscoso	δ 8,40 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 7,30-7,25 (m, 2H), 6,75-6,68 (m, 2H), 5,81 (s, 1 H), 5,32 (t, J=4,5, 1H), 4,50-4,46 (m, 1 H), 4,19 (d, J=4,5, 2H), 4,12-4,01 (m, 2H), 3,99-3,86 (m, 4H), 3,48-3,40 (m, 1H), 3,31-3,24 (m, 1H), 2,26-2,18 (m, 1H), 2,15-2,08 (m, 1H), 1,90-1,81 (m, 1H), 1,11 (d, J= 6,8, 3H)
1a-303	Líquido viscoso	δ 8,56-8,54 (m, 1H), 8,40 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,80 (dt, J1 =7,7, J2=2,1, 1H), 7,74 (d, J=8,0, 1H), 7,63 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 7,41 (dd, J1=3,7, J2=1,0, 1H), 7,30 (dd, J1=4,9, J2=1,0, 1H), 7,24-7,20 (m, 1H), 7,07 (dd, J1=4,5, J2=3,7, 1H), 6,68 (d, J=8,8, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,70-4,64 (m, 1H), 3,88-3,81 (m, 2H), 3,78-3,71 (m, 2H), 2,12-1,98 (m, 4H)
1a-304	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,2, 1H), 5,79 (s, 1H), 5,79-5,68 (m, 1H), 5,08-5,01 (m, 2H), 4,51-4,45 (m, 1H), 4,07 (t, J=7,2, 2H), 3,98-3,91 (m, 2H), 3,66-3,58 (m, 2H), 2,59 2,53 (m, 2H), 2,13-2,04 (m, 2H), 1,95-1,87 (m, 2H)
1a-305	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J= 9,0, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,52-4,45 (m, 1H), 3,97-3,91 (m, 2H), 3,89 (d, J=7,2, 2H), 3,66-3,59 (m, 2H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,95-1,85 (m, 3H), 1,33-1,24 (m, 4H), 0,87 (t, J=7,4, 6H)

Tabla 57

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1a-306	Líquido viscoso	δ 8,41 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=9,2, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,52-4,45 (m, 1H), 4,02 (seu do-t, J=7,4, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,67-3,59 (m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H), 1,96-1,87 (m, 2H), 1,73- 1,66 (m, 2H), 1,61-1,50 (m, 1H), 0,92 (d, J=6,6, 6H)
1b-2	Líquido viscoso	δ 8,39 (seu do-d, J=2,5, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 6,67 (d, J=9,0, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,82-4,73 (m, 1H), 4,01-3,90 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,63-3,53 (m, 2H), 2,12-2,00 (m, 2H), 1,92-1,80 (m, 2H)
1b-4	Líquido viscoso	δ 8,40 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,70 (d, J=8,8, 1H), 6,40 (s, 1H), 5,04-4,97 (m, 1H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,67-3,60 (m, 2H), 3,01 (t, J=7,4, 2H), 2,16-2,07 (m, 2H), 1,97-1,88 (m, 2H), 1,79-1,68 (m, 2H), 1,49-1,39 (m, 2H), 0,96 (t, J=7,3, 3H)
1b-31	Líquido viscoso	δ 8,40 (seu do-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1=8,9, J2=2,6, 1H), 6,68 (d, J=8,9, 1H), 6,13 (s, 1H), 5,34 (s, 2H), 4,91-4,85 (m, 1H), 4,00-3,93 (m, 2H), 3,62-3,55 (m, 2H), 3,88 (s, 3H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,92-1,83 (m, 2H)

ES 2 382 481 T3

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1b-32	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,2, 1H), 6,12 (s, 1H), 5,38 (s, 2H), 4,90-4,84 (m, 1H), 4,00-3,93 (m, 2H), 3,62-3,54 (m, 4H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,92-1,83 (m, 2H), 1,19 (t, J=7,0, 3H)
1b-33	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,6, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 6,11 (s, 1H), 5,38 (s, 2H), 4,48-4,41 (m, 2H), 4,29-4,21 (m, 1H), 3,58 (q, J=7,0, 2H), 3,28-3,20 (m, 1H), 2,94-2,87 (m, 1H), 2,33-2,26 (m, 1H), 2,02-1,90 (m, 1H), 1,70-1,60 (m, 1H), 1,19 (t, J=7,0, 3H), 1,08 (t, J=6,4, 3H)

Tabla 58

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1b-34	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,2, 1H), 6,01 (s, 1H), 4,82-4,76 (m, 1H), 4,21 (t, J=5,9, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,77 (t, J=5,9, 2H), 3,63-3,55 (m, 2H), 3,45 (s, 3H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,92-1,83 (m, 2H)
1b-35	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,68 (d, J=9,1, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,82-4,76 (m, 1H), 4,21 (t, J=6,1, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,79 (t, J=6,1, 2H), 3,62-3,55 (m, 2H), 3,48 (q, J=7,0, 2H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,92-1,82 (m, 2H), 1,16 (t, J=7,0, 3H)
1b-36	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,68 (d, J=9,1, 1H), 6,02 (s, 1H), 4,82-1,77 (m, 1H), 4,77 (t, J=5,5, 1H), 4,14 (d, J=5,5, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,63-3,55 (m, 2H), 3,38 (s, 6H), 2,10-2,03 (m, 2H), 1,92-1,85 (m, 2H)
1b-37	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1=9,1, J2=2,6, 1H), 6,67 (d, J=9,1, 1H), 6,01 (s, 1H), 4,77 (t, J=5,5, 1H), 4,41-4,35 (m, 1H), 4,28-4,22 (m, 2H), 4,13 (d, J=5,5, 2H), 3,38 (s, 6H), 3,28-3,20 (m, 1H), 2,94-2,88 (m, 1H), 2,30-2,24 (m, 1H), 2,02-1,90 (m, 1H), 1,70-1,60 (m, 1H), 1,08 (d, J=6,4, 3H)
1b-38	Líquido viscoso	δ 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,60 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J=9,2, 1H), 6,04 (s, 1H), 4,79-4,76 (m, 2H), 4,13 (d, J=5,4, 2H), 4,00-3,95 (m, 2H), 3,49-3,42 (m, 1H), 3,38 (s, 6H), 3,36-3,28 (m, 1H), 2,19-2,12 (m, 1H), 2,11-2,00 (m, 1H), 1,84-1,75 (m, 1H), 1,05 (d, J=6,8, 3H)

Tabla 59

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1b-39	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,2, 1H), 6,01 (s, 1H), 4,87 (t, J=5,5, 1H), 4,83-4,76 (m, 1H), 4,14 (d, J=5,5, 2H), 4,00-3,93 (m, 2H), 3,77-3,68 (m, 2H), 3,62-3,55 (m, 2H), 3,48-3,39 (m, 2H), 2,11-2,03 (m, 2H), 1,92-1,84 (m, 2H), 1,15 (t, J=7,2, 6H)
1b-40	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,61 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J=9,2, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,87 (t, J=5,5, 1H), 4,41-4,34 (m, 1H), 4,29-4,24 (m, 2H), 4,13 (d, J=5,5, 2H), 3,77-3,68 (m, 2H), 3,48-3,39 (m, 2H), 3,27-3,19 (m, 1H), 2,93-2,87 (m, 1H), 2,30-2,24 (m, 1H), 2,00-1,90 (m, 1H), 1,71-1,60 (m, 1H), 1,15 (t, J=7,2, 6H), 1,08 (d, J=6,4, 3H)
1b-41	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=8,8, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,82-4,75 (m, 1H), 4,44 (t, J=5,6, 1H), 4,11 (t, J=7,3, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,61-3,54 (m, 2H), 3,31 (s, 6H), 2,19-2,13 (m, 2H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,91-1,82 (m, 2H)
1b-42	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,81-4,75 (m, 1H), 4,57 (t, J=5,5, 1H), 4,13 (t, J=7,3, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,71-3,62 (m, 2H), 3,61-3,54 (m, 2H), 3,54-3,46 (m, 2H), 2,20-2,14 (m, 2H), 2,10-2,00 (m, 2H), 1,91-1,82 (m, 2H), 1,21 (t, J=7,0, 6H)
1b-43	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J=9,2, 1H), 6,04 (s, 1H), 5,34 (t, J=4,6, 1H), 4,85-4,79 (m, 1H), 4,16 (d, J=4,6, 2H), 4,01-3,89 (m, 6H), 3,63-3,55 (m, 2H), 2,10-2,00 (m, 2H), 1,91-1,82 (m, 2H)

Tabla 60

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1b-44	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,61 (dd, J1=8,9, J2=2,6, 1H), 6,67 (d, J=8,9, 1H), 6,02 (s, 1H), 5,35 (t, J=4,6, 1H), 4,42-4,36 (m, 1H), 4,28-4,20 (m, 2H), 4,15 (d,

ES 2 382 481 T3

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		J=4,6, 2H), 4, 00-3,89 (m, 4H), 3,28-3,21 (m, 1H), 2, 94-2,87 (m, 1 H), 2, 33-2,25 (m, 1H), 2,00-1,91 (m, 1H), 1,70-1,59 (m, 1H), 1,08 (d, J=6,8, 3H)
1b-45	Líquido viscoso	δ 8,38 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,60 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,66 (d, J= 9,0, 1H), 6,06 (s, 1H), 5,34 (t, J=4,6, 1H), 4,79-4,75 (m, 1H), 4,16 (d, J=4,6, 2H), 4,00-3,89 (m, 6H), 3,49-3,41 (m, 1H), 3,34-3,27 (m, 1H), 2,20-2,13 (m, 1H), 2,08-2,01 (m, 1H), 1,83-1,74 (m, 1H), 1,05 (d, J=6,8, 3H)
1b-46	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J= 9,0, 1H), 6,01 (s, 1H), 4,82-4,76 (m, 1H), 4,41-4,33 (m, 1H), 4, 15-4,08 (m, 1H), 4,03-3,85 (m, 4H), 3,82-3,75 (m, 1H), 3,63-3,55 (m, 2H), 2,10-1,98 (m, 3H), 1,96-1,83 (m, 4H), 1,75-1,66 (m, 1H)
1b-47	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J= 9,2, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,96 (t, J=4,4, 1H), 4,82-4,76 (m, 1H), 4,19 (t, J=7,5, 2H), 4,02-3,91 (m, 4H), 3,90-3,85 (m, 2H), 3,61-3,54 (m, 2H), 2,26-2,20 (m, 2H), 2,09-2,02 (m, 2H), 1,91-1,81 (m, 2H)
1b-48	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,67 (d, J= 9,2, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,83-4,76 (m, 1H), 4,59 (t, J=5,0, 1H), 4,18-4,08 (m, 4H), 4,00-3,93 (m, 2H), 3,78-3,70 (m, 2H), 3,60-3,53 (m, 2H), 2,18-2,02 (m, 5H), 1,90-1,81 (m, 2H), 1,35 (seudo-d, J=13,2, 1H),
1b-49	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J= 9,2, 1H), 6,02 (s, 1H), 4,81-4,76 (m, 1H), 4,15-4,10 (m, 2H), 4,00-3,93 (m, 2H), 3,62-3,55 (m, 2H), 2,19-2,03 (m, 6H), 1,90-1,82 (m, 2H)

Tabla 61

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1b-50	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,58 (d, J=8,8, 1H), 5,92 (s, 1H), 5,09-5,01 (m, 1H), 4,75 (t, J=5,5, 1H), 4,65 (br-s, 2H), 4,11 (d, J=5,5, 2H), 3,67 (s, 6H), 2,24-2,13 (m, 4H), 1,94-1,88 (m, 2H), 1,82-1,75 (m, 2H)
1b-51	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J= 8,8, 1H), 5,63 (s, 1H), 5,35 (t, J= 4,6, 1H), 5,10-5,00 (m, 1H), 4,64 (br-s, 2H), 4,13 (d, J=4,6, 2H), 4,01-3,89 (m, 4H), 2,24-2,12 (m, 4H), 1, 94-1,83 (m, 2H), 1,81-1,74 (m, 2H)
1b-52	74,5-75,0	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1=8,9, J2=2,6, 1H), 6,61 (d, J= 8,9, 1H), 6,03 (s, 1H), 4,79 (t, J=5,5, 1H), 4,72 (br-s, 1H), 4,19-4,13 (m, 4H), 3,38 (s, 6H), 3,12 (d, J=12,4, 2H), 2,61 (br-s, 2H), 2,00-1,96 (m, 2H), 1,62-1,56 (m, 2H)
1b-53	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,61 (d, J= 9,0, 1H), 6,05 (s, 1H), 5,37 (t, J=5,2, 1H), 4,73 (br-s, 1H), 4,18-4,13 (m, 4H), 4,01-3,89 (m, 4H), 3,12 (d, J=12,4, 2H), 2,61 (br-s, 2H), 2,20-1,95 (m, 2H), 1,61-1,55 (m, 2H)
1b-54	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,2, 1H), 7,62 (dd, J1=8,9, J2=2,4, 1H), 7,11-7,06 (m, 2H), 6,89-6,83 (m, 1H), 6,68 (d, J=8,9, 1H), 5,76 (s, 1H), 5,36 (t, J=4,4, 1H), 4,86-4,81 (m, 1H), 4,07 (d, J= 4,4, 2H), 4,01-3,94 (m, 2H), 3,89 (br-s, 4H), 3,64-3, 57 (m, 2H), 2,12-2,06 (m, 2H), 1,95-1,86 (m, 2H)
1b-55	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,61 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 7,13-7,05 (m, 2H), 6,89-6,82 (m, 1H), 6,68 (d, J=9,0, 1H), 5,75 (s, 1H), 5,36 (t, J=4,4, 1H), 4,45-4,38 (m, 1H), 4,30-4,22 (m, 2H), 4,06 (d, J=4,4, 2H), 3,89 (seudo-s, 4H), 3,31-3,23 (m, 1H), 2,97-2,90 (m, 1H), 2,38-2,31 (m, 1H), 2,02-1,94 (m, 1H), 1,74-1,63 (m, 1H), 1,11 (d, J=6,4, 3H)

Tabla 62

nº	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1b-56	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J= 1,7, 1H), 7,62 (dd, J1=8,5, J2=2,4, 1H), 7,08 (dd, J1=7,9, J2=2,2, 2H), 6,89-6,82 (m, 1H), 6,62 (d, J= 9,0, 1H), 5,76 (s, 1H), 4,80 (t, J= 5,4, 1H), 4,70 (s, 1 H), 4,17 (dd, J1=12,9, J2=3,3, 2H), 4,03 (d, J= 5,5, 2H), 3,35 (s, 6H), 3,14 (d, J=11,4, 2H), 2,65 (br-s, 2H), 2,05-2,00 (m, 2H), 1,63-1,59 (m, 2H)
1b-57	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,61 (dd, J1= 8,8, J2=2,4, 1H), 6,55 (d, J= 8,8, 1H), 6,00 (s, 1H), 4,77-4,70 (m, 2H), 4,54 (br-s, 2H), 4,11 (d, J=5,6, 2H), 3,36 (s, 6H), 2,33-2,28 (m, 2H), 2,20-2,13 (m, 2H), 2,10-2,01 (m, 4H)
1b-58	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,2, 1H), 7,60 (dd, J1= 8,9, J2=2,2, 1H), 6,54 (d, J= 8,9, 1H), 6,01 (s, 1H), 5,32 (t, J= 4,7, 1H), 4,73 (seudo-t, J=4,4, 1H), 4,54 (br-s, 2H), 4,14

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		(d, J=4,7, 2H), 4,00-3,88 (m, 4H), 2,33-2,27 (m, 2H), 2,19-2,12 (m, 2H), 2,10-1,97 (m, 4H)
1b-59	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1= 8,9, J2=2,6, 1H), 6,68 (d, J= 8,9, 1H), 5,98 (s, 1H), 5,82-5,71 (m, 1H), 5,12-5,05 (m, 2H), 4,82-4,75 (m, 1H), 4,09 (seudo-t, J= 7,4, 2H), 3,9 9-3,92 (m, 2H), 3,63-3,55 (m, 2 H), 2,63-2,56 (m, 2H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,92-1,83 (m, 2H)
1b-60	Líquido viscoso	δ 8,39 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1= 8,8, J2=2,4, 1H), 6,68 (d, J= 8,8, 1H), 5,99 (s, 1H), 4,79-4,73 (m, 1H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,91 (d, J=7,6, 2H), 3,62-3,55 (m, 2H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,99-1,82 (m, 3H), 1,38-1,27 (m, 4H), 0,88 (t, J=7,5, 6H)
1b-61	61,3-61,7	δ 8,39 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,62 (dd, J1= 9,1, J2=2,6, 1H), 6,67 (d, J= 9,1, 1H), 5,97 (s, 1H), 4,79-4,7 4 (m, 1H), 4,05 (seu do-t, J= 7,8, 2H), 3,99-3,92 (m, 2H), 3,63-3,55 (m, 2H), 2,10-2,02 (m, 2H), 1,91-1,82 (m, 2H), 1,76-1,69 (m, 2H), 1,69-1,58 (m, 1H), 0,95 (d, J=6,5, 6H)

Tabla 63

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1d-6	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,64 (dd, J1=8,9, J2=2,3, 1H), 6, 57 (d, J=8,9, 1H), 5,61 (s, 1H), 4,60 (br-s, 2H), 4,41 (seudo-t, J=4,8, 1H), 4,03 (t, J=7,3, 2H), 2,29-2,16 (m, 6H), 2,06 (seudo-d, J=14,5, 2H), 1,87-1,79 (m, 2H), 1,42- 1,32 (m, 2H), 0,96 (t, J=7,4, 3H)
1d-37	65,4-66,0	δ 10,26 (br-s, 1H), 8,41 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,63 (dd, J1=8,9, J2=2,6, 1H), 6,57 (d, J=8,9, 1H), 5,82 (s, 1H), 4,56 (seudo-s, 3H), 2,26-2,03 (m, 8H)
1d-38	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,63 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,57 (d, J=9,0, 1H), 5,63 (s, 1H), 4,08 (t, J=5,6, 1H), 4,59 (br-s, 2H), 4,42 (seudo-t, J=4,6, 1H), 4,12 (d, J=5,6, 2H), 3, 40 (s, 6 H), 2, 28-2,21 (m, 4H), 2,17-2, 13 (m, 2H), 2,06 (seudo-d, J=14,8, 2H)
1d-39	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6, 57 (d, J=8,8, 1H), 5,64 (s, 1H), 5,31 (t, J=4,4, 1H), 4,59 (br-s, 2H), 4,43 (seudo-t, J=4,6, 1H), 4,18 (d, J=4,4, 2H), 3,99-3,89 (m, 4H), 2,31-2,20 (m, 4H), 2,19-2,13 (m, 2H), 2,07 (seudo-d, J=15,0, 2H)
1d-40	185,6-186,1	δ 9,76 (br-s, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,62 (dd, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 7,09-7,05 (m, 2H), 6,83-6,76 (m, 1H), 6,56 (d, J=8,8, 1H), 5,92 (s, 1H), 4,72 (br-s, 1H), 4,56 (br-s, 2H), 2,36-2,30 (m, 2H), 2,23-2,16 (m, 2H), 2,13-2,04 (m, 4H)
1d-41	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J= 2,4, 1H), 7,64 (dd, J1= 8,8, J2= 2,4, 1H), 7,26-7, 21 (m, 2H), 6,75-6,68 (m, 1H), 6,58 (d, J=8,8, 1H), 5,64 (s, 1H), 4,85 (t, J=5,6, 1H), 4,59 (br-s, 2H), 4,46 (seudo-t, J=4,5, 1H), 4,12 (d, J=5,6, 2H), 3,41 (s, 6H), 2,33-2,22 (m, 4H), 2,17-2,08 (m, 4H)
1d-42	114,5-114,9	δ 8,42 (seudo-d, J= 2,4, 1H), 7,64 (dd, J1= 8,8, J2= 2,4, 1H), 7,27-7, 21 (m, 2H), 6,74-6,68 (m, 1H), 6,58 (d, J=8,8, 1H), 5,65 (s, 1H), 5,36 (t, J=4,6, 1H), 4,60 (br-s, 2H), 4,46 (seu do-t, J=4,5, 1H), 4,18 (d, J= 4,6, 2H), 4,02- 3,90 (m, 4H), 2,34-2,2 3 (m, 4H), 2,18-2,14 (m, 4H)

Tabla 64

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1e-3	93,1-93,3	δ 8,44 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,66 (d d, J1=8,9, J2=2,4, 1H), 6,61 (d, J= 8,9, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,74-4,60 (m, 3H), 3,59(s, 3H), 2,25-2,13 (m, 4H), 1,92-1,77 (m, 4H)
1e-6	Líquido viscoso	δ 8,44 (seudo-d, J=2,3, 1H), 7,66 (d d, J1=8,9, J2=2,3, 1H), 6,60 (d, J= 8,9, 1H), 5,76 (s, 1H), 4 ,75-4,61 (m, 3H), 3,88 (t, J= 7,2, 2H), 2,26-2,14 (m, 4H), 1,91-1,77 (m, 4H), 1,75-1,60 (m, 2H), 1,29-1,18 (m, 2H), 0,86 (t, J=7,4, 3H)
1e-37	Líquido viscoso	δ 8,53-8,50 (m, 1H), 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,78 (seudo-t, J= 7,8, 1H), 7,62 (dd, J1=8,9, J2=2,4, 1H), 7, 56 (d, J= 8,2, 1H), 7,28-7,24 (m, 1H), 6,58 (d, J=8,9, 1H), 5,99 (s, 1H), 4,87-4,77 (m, 1H), 4,69 (br-s, 2H), 2,27-2,21 (m, 2H), 2,20-2,13 (m, 2H), 1,92-1,82 (m, 4H)
1e-38	164,8-165,2	δ 9,70 (br-s, 1H), 8,43 (seu do-d, J=2,3, 1H), 7,65 (dd, J1 =8,9, J2=2,3, 1H), 6,60 (d, J=8,9, 1H), 5,87 (s, 1H), 4,86 (s, 1H), 4,67 (s, 2H), 2,21- 2,15 (m, 4H), 1,90-1,78 (m, 4H)
1e-39	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,66 (d d, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,60 (d, J= 8,8, 1H),

ES 2 382 481 T3

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
		5,78 (s, 1H), 4,74-7,65 (m, 4 H), 4,40 (d, J=5,7, 2H), 3,29 (s, 6H), 2,2-2,16 (m, 4H), 1,88-1,80 (m, 4H)
1e-40	142,6-143,0	δ 8,44 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,66 (d d, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 6,60 (d, J= 8,8, 1H), 5,80 (s, 1H), 5,20 (t, J= 4,6, 1H), 4,75-4,66 (m, 3H), 4,04 (d, J=4,6, 2H), 3,89-3,79 (m, 4H), 2,22-2,16 (m, 4H), 1,87-1,80 (m, 4H)
1e-41	151,4-151,9	δ 9,67 (br-s, 1 H), 8,43 (seu do-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1 =8,9, J2=2,4, 1H), 7,08 (d, J=5,7, 2H), 6,82-6,76 (m, 1H), 6,60 (d, ,J=8,9, 1H), 5,88 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 4,66 (s, 2H), 2,27-2,22 (m, 2H), 2,18-2,13 (m, 2H), 1,96-1,89 (m, 2H), 1,86-1,79 (m, 2H)

Tabla 65

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1e-42	118,3-119,2	δ 8,44 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,66 (d d, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 7,30-7,22 (m, 2H), 6,75-6,69 (m, 1H), 6,60 (d, J=8,8, 1H), 5,80 (s, 1H), 4,75 (t, J=5,7, 1H), 4,74-7,66 (m, 3H), 4,00 (d, J=5,7, 2H), 3,31 (s, 6H), 2,25-2,17 (m, 4H), 1,91-1,82 (m, 4H)
1e-43	131,0-131,9	δ 8,45 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,67 (d d, J1=8,8, J2=2,4, 1H), 7,30-7,23 (m, 2H), 6,75-6,68 (m, 1H), 6,61 (d, J=8,8, 1H), 5,82 (s, 1H), 5,24 (t, J=4,7, 1H), 4,78-4,69 (m, 3H), 4,04 (d, J=4,7, 2H), 3,92-3,81 (m, 4H), 2,25-2,17 (m, 4H), 1,91-1,82 (m, 4H)
1f-3	102,3-102,9	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,62 (d, J= 9,0, 1H), 5,84 (s, 1H), 4,45 (s, 1H), 4,23 (seudo-dd, J1=12,9, J2=3,5, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,09 (seudo-d, J=12,9, 2H), 2,65 (br-s, 2H), 2,00-1,92 (m, 2H), 1,72-1,62 (m, 2H)
1f-6	Líquido viscoso	δ 8,41 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (d d, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,62 (d, J= 9,0, 1H), 5,81 (s, 1H), 4,45 (s, 1H), 4,23 (seu do-dd, J1=12,8, J2=3,4, 2H), 3,97 (t, J= 7,2, 2H), 3,19 (seudo-d, J= 12,8, 2H), 2,65 (br-s, 2H), 1,98-1,90 (m, 2H), 1,83-1,72 (m, 2H), 1,71-1,63 (m, 2H), 1,38-1,22 (m, 2H), 0,93 (t, J=7,4, 3H)
1f-37	199,5-200,3	δ 10,35 (br-s, 1H), 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,62 (d, J=9,0, 1H), 5,94 (s, 1H), 4,56 (br-s, 1H), 4,20 (dd, J1=12,7, J2=3,4, 2H), 3,10 (d, J=12,7, 2H), 2,64 (br-s, 2H), 2,00-1,90 (m, 2H), 1,67-1,60 (m, 2H)
1f-38	91,9-92,5	δ 8,40 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,64 (d d, J1=9,2, J2=2,4, 1H), 6,62 (d, J= 9,2, 1H), 5,83 (s, 1H), 4,77 (t, J=5,7, 1H), 4,46 (br-s, 1H), 4,23 (dd, J1=12,9, J2=3,4, 2H), 40,7 (d, J=5,7, 2H), 3,36 (s, 6H), 3,09 (d, J=12,9, 2H), 2,65 (br-s, 2H), 1,99-1,95 (m, 2H), 1,68-1,62 (m, 2H)

Tabla 66

n°	Propiedades o punto de fusión (°C)	datos RMN ¹ H
1f-39	Líquido viscoso	δ 8,40 (seudo-d, J=2,6, 1H), 7,64 (d d, J1=8,9, J2=2,6, 1H), 6,62 (d, J=8, 9, 1H), 5,85 (s, 1H), 5,27 (t, J=4,5, 1H), 4,47 (br-s, 1H), 4,23 (d d, J1=12,8, J2=3,2, 2H), 4,12 (d, J=4,5, 2H), 3,97-3,87 (m, 4H), 3,09 (d, J= 12,8, 2H), 2,66 (br-s, 2H), 2,03-1,90 (m, 2H), 1,69-1,62 (m, 2H)
1f-40	141,9-142,2	δ 8,40 (seudo-d, J=1,6, 1H), 7,64 (dd, J1= 9,0, J2=2,4), 7,30-7,26 (m, 2H), 6,76-6,70 (m, 1H), 6,62 (d, J= 9,0, 1H), 5,84 (s, 1H), 4,81 (t, J=5,6, 1H), 4,50 (s, 1H), 4,22 (dd, J1=13,1, J2=3,4, 2H), 4,07 (d, J=5,7, 2H), 3,38 (s, 6H), 3,11 (d, J= 12,5, 2H), 2,68 (br-s, 2H), 2,01-1,98 (m, 2H), 1,68-1,63 (m, 2H)
1f-41	183,3-184,8	δ 9,60 (br-s, 1 H), 8,40 (s, 1 H), 7,62 (dd, J1=9,0, J2=2,5, 1H), 7,08 (d d, J1=8,0, J2=2,0, 2H), 5,84-6,78 (m, 1 H), 6,61 (d, J1 =9,0, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,73 (s, 1H), 4,18 (dd, J1= 12,8, J2=3,1, 2H), 3,13 (d, J= 12,4, 2H), 2,66 (s, 2H), 2,01-1,99 (m, 2H), 1,64-1,59 (m, 1H)
1g-3	113,2-113,5	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,63 (d, J= 9,0, 1H), 5,86 (s, 1H), 4,51 (t, J= 5,0, 1H), 3,96 (seudo-dd, J1=12,5, J2=2,6, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,35 (seudo-d, J=11,6, 2H), 2,59 (br-s, 2H), 1,90-1,85 (m, 2H), 1,78-1,71 (m, 2H)
1g-6	Líquido viscoso	δ 8,42 (seudo-d, J=2,4, 1H), 7,65 (dd, J1=9,0, J2=2,4, 1H), 6,62 (d, J= 9,0, 1H), 5,84 (s, 1H), 4,52 (t, J= 5,0, 1H), 3,99 (t, J= 7,2, 2H), 3,95 (seu do-dd, J1= 12,4, J2=2,4, 2H), 3,34 (seu do-d, J=11,4, 2H), 2,60 (br-s, 2H), 1,92-1,85 (m, 2H), 1,80-1,69 (m, 4H), 1,30-1,18 (m, 2H), 0,81 (t, J=7,4, 3H)

Ejemplo 1 de Formulación. Concentrado emulsionable

Se disolvieron 10 partes de cada compuesto de la invención en 45 partes de Solvesso 150 y 35 partes de N-metilpirrolidona. A la disolución se añadieron 10 partes de un emulsionante (nombre comercial: Sorpol 3005X, fabricado por Toho Kagaku Co., Ltd.). Estos ingredientes se mezclaron mediante agitación para producir un concentrado emulsionable al 10%.

Ejemplo 2 de Formulación. Polvo humectable

Se añadieron 20 partes de cada compuesto de la invención a una mezcla de 2 partes de laurilsulfato de sodio, 4 partes de lignosulfonato de sodio, 20 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, y 54 partes de arcilla. Estos ingredientes se mezclaron mediante agitación con una mezcladora para producir un polvo humectable al 20%.

Ejemplo 3 de Formulación. Gránulo

Se añadieron dos partes de dodecibencenosulfonato de sodio, 10 partes de bentonita, y 83 partes de arcilla a 5 partes de cada compuesto de la invención. Estos ingredientes se mezclaron a conciencia con agitación. Después de añadir un acantidad apropiada de agua, la mezcla se agitó adicionalmente. La mezcla se granuló con una granuladora, y se secó al aire para producir gránulos al 5%.

Ejemplo 4 de Formulación. Polvo fino

Se disolvió 1 parte de cada compuesto de la invención en una cantidad adecuada de acetona. A la disolución se añadieron 5 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 0,3 partes de PAP (fosfato ácido de isopropilo), y 93,7 partes de arcilla. Estos ingredientes se mezclaron agitando con una mezcladora de zumos. La acetona se eliminó de allí mediante evaporación para producir un polvo suelto al 1%.

Ejemplo 5 de Formulación. Gránulos dispersables en agua

20 partes de cada compuesto de la invención y 1,5 partes de trioleato de sorbitán se mezclaron con 28,5 partes de una disolución acuosa que contiene dos partes de polialcohol vinílico. La mezcla se pulverizó con una trituradora de arena (hasta un tamaño de partículas de 3 micrómetros o menos). Se le añadieron 40 partes de una disolución acuosa que contiene 0,05 partes de goma de xantano y 0,1 partes de silicato de aluminio y magnesio, seguido de la adición de 10 partes de propilenglicol. Estos ingredientes se mezclaron mediante agitación para producir una suspensión al 20% en agua.

Los compuestos de la invención se ensayaron como se muestra en los Ejemplos de Ensayo más abajo, para demostrar que los compuestos son útiles como principio activo de acaricidas. Los compuestos de la invención se indican mediante los Nos. de Compuesto mostrados en las Tablas 1 a 24.

Ejemplo 1 de ensayo. Ensayo sobre ácaros de dos puntos

Una copa de plástico (nombre comercial: KP-120, fabricada por Konoike Plastic Co., Ltd., Iwata) se llenó con agua del grifo, y se cubrió con una tapa que tiene un corte de entalladura en ella. Sobre la tapa se colocó un trozo de tejido no tejido (4,5 x 5,5 cm) que tiene una ranura de alrededor de 4 cm de longitud, siendo la ranura paralela al lado más largo del tejido a una distancia de 1 cm desde el borde. La porción del tejido de alrededor de 4 cm de longitud y 1 cm de anchura se suspendió dentro de la copa de plástico a través de la entalladura. Se colocó una hoja de frijol rojo (alrededor de 3,5 x 4,5 cm) sobre el tejido no tejido suicientemente empapado. Sobre la hoja se liberaron ácaros de dos puntos (alrededor de veinte ácaros), y la hoja se colocó en una cámara termostática (25±2°C, 16L8D). Al día siguiente, se preparó una formulación acaricida que contiene un compuesto de la invención (500 ppm) añadiendo una disolución acuosa de Sorpol 355 (fabricado por Toho Kagaku Co., Ltd.) (100 ppm) a una disolución de acetona que contiene el compuesto de la invención. Se pulverizaron 4 ml de la formulación acaricida sobre la hoja con una pistola de pulverización ("PB-308 Piece Bon", Olympos, Osaka; 1 kgf/cm²). La hoja se secó al aire, y después se colocó en una cámara termostática. La mortalidad de los ácaros de dos puntos se determinó dos días después de la pulverización.

Como resultado, se logró una mortalidad de al menos 50% usando los siguientes compuestos de la invención: Compuestos Nos. 1a-2, 1a-14 a 1a-19, 1a-24, 1a-28, 1a-45, 1a-46, 1a-50 a 1a-53, 1a-62, 1a-69, 1a-70, 1a-75 a 1a-77, 1a-79, 1a-81, 1a-99 a 1a-101, 1a-103, 1a-106 a 1a-108, 1a-126, 1a-127, 1a-145, 1a-173, 1a-174, 1a-200 a 1a-208, 1a-210 a 1a-214, 1a-216, 1a-221, 1a-223 a 1a-236, 1a-238, 1a-240 a 1a-242, 1a-247 a 1a-258, 1a-261 a 1a-282, 1a-288, 1a-297 a 1a-306, 1b-2, 1b-4, 1b-31 a 1b-50, 1b-52, 1b-53, 1b-56 a 1b-61, 1d-6, 1d-41, 1d-42, 1f-3, 1f-6, y 1f-38 a 1f-40.

Entre estos, se logró una mortalidad de 100% usando los siguientes compuestos de la invención: Compuestos Nos. 1a-2, 1a-14 a 1a-19, 1a-24, 1a-28, 1a-45, 1a-46, 1a-50 a 1a-53, 1a-62, 1a-69, 1a-70, 1a-75 a 1a-77, 1a-81, 1a-99,

1a-100, 1a-106, 1a-108, 1a-126, 1a-127, 1a-173, 1a-174, 1a-200 a 1a-208, 1a-210 a 1a-214, 1a-216, 1a-224 a 1a-236, 1a-240 a 1a-242, 1a-247, 1a-249, 1a-251 a 1a-258, 1a-261 a 1a-282, 1a-297 a 1a-306, 1b-2, 1b-4, 1b-31 a 1b-41, 1b-43 a 1b-47, 1b-49, 1b-57, 1b-59 a 1b-61, 1d-6, 1d-41, 1d-42, 1f-3, 1f-6, y 1f-38 a 1f-40.

5 **Ejemplo 2 de Ensayo. Ensayo ovicida sobre ácaros de dos puntos**

Una copa de plástico (nombre comercial: KP-120, fabricada por Konoike Plastic Co., Ltd., Iwata) se llenó con agua del grifo, y se cubrió con una tapa que tiene un corte de entalladura en ella. Sobre la tapa se colocó un trozo de tejido no tejido (4,5 x 5,5 cm) que tiene una ranura de alrededor de 4 cm de longitud, siendo la ranura paralela al lado más largo del tejido a una distancia de 1 cm desde el borde. La porción del tejido de alrededor de 4 cm de longitud y 1 cm de anchura se suspendió dentro de la copa de plástico a través de la entalladura. Se colocó una hoja de frijol rojo (alrededor de 3,5 x 4,5 cm) sobre el tejido no tejido suficientemente empapado. Sobre la hoja se liberaron ácaros de dos puntos a dultos hembras (alrededor de 5 ácaros), y la hoja se colocó en una cámara termostática (25±2°C, 16L8D). Al día siguiente, los ácaros hembra se eliminaron, y se pulverizaron sobre la hoja con una pistola de pulverización ("PB-308 Piece Bon", Olympos, Osaka; 1 kgf/cm²) 4 ml de una formulación acaricida que contiene un compuesto de ensayo (500 ppm), que se preparó según el Ejemplo 1 de Ensayo. La hoja se secó al aire, y después se colocó en una cámara termostática. La tasa ovicida de los ácaros de dos puntos se determinó seis días después de la pulverización.

20 Como resultado, se logró una tasa ovicida de al menos 50% usando los siguientes compuestos de la invención: Compuestos Nos. 1a-2, 1a-14 a 1a-19, 1a-24, 1a-26, 1a-28, 1a-45, 1a-46, 1a-50, 1a-51, 1a-53, 1a-60, 1a-62, 1a-69, 1a-70, 1a-75 a 1a-77, 1a-81, 1a-99, 1a-100, 1a-106, 1a-108, 1a-126, 1a-127, 1a-173, 1a-174, 1a-200 a 1a-208, 1a-210 a 1a-214, 1a-216, 1a-221, 1a-223 a 1a-236, 1a-240, 1a-242, 1a-247 a 1a-258, 1a-261 a 1a-281, 1a-297 a 1a-306, 1b-4, 1b-31 a 1b-49, 1b-57 a 1b-61, 1d-6, 1d-41, 1d-42, 1f-3, 1f-6 and 1f-38 a 1f-40.

25 Entre estos, se logró una tasa ovicida de 100% usando los siguientes compuestos de la invención: Compuestos Nos. 1a-15 a 1a-19, 1a-24, 1a-28, 1a-45, 1a-46, 1a-50, 1a-51, 1a-53, 1a-62, 1a-69, 1a-70, 1a-75 a 1a-77, 1a-99, 1a-100, 1a-106, 1a-108, 1a-127, 1a-173, 1a-174, 1a-200 a 1a-208, 1a-210 a 1a-214, 1a-216, 1a-224 a 1a-234, 1a-236, 1a-240, 1a-242, 1a-247, 1a-249, 1a-251 a 1a-254, 1a-256 a 1a-258, 1a-261 a 1a-277, 1a-297 a 1a-306, 1b-4, 1b-31 a 1b-41, 1b-43 a 1b-47, 1b-49, 1b-57, 1b-59 a 1b-61, 1d-6, 1d-41, 1f-3, 1f-6, and 1f-38 a 1f-40.

30 **Ejemplo 3 de Ensayo. Ensayo en ácaros rojos de cítricos**

Una copa de plástico (nombre comercial: KP-120, fabricada por Konoike Plastic Co., Ltd., Iwata) se llenó con agua del grifo, y se cubrió con una tapa que tiene un corte de entalladura en ella. Sobre la tapa se colocó un trozo de tejido no tejido (4,5 x 5,5 cm) que tiene una ranura de alrededor de 4 cm de longitud, siendo la ranura paralela al lado más largo del tejido a una distancia de 1 cm desde el borde. La porción del tejido de alrededor de 4 cm de longitud y 1 cm de anchura se suspendió dentro de la copa de plástico a través de la entalladura. Se colocó una hoja de Citrus aurantium (3 cm x 3 cm) con la cara boca arriba sobre el tejido no tejido suficientemente empapado. Para evitar el secado y el escape de los ácaros, la hoja se cubrió con un papel de filtro (diámetro: 5 cm, No. 2, Advante c Toyo Kaisha, Ltd.) que tiene un orificio de 2,4 cm de diámetro, y se rodeó de una maraña (Fujitangle). Después, se liberaron 10 ácaros rojos de cítricos hembras adultos sobre la hoja de Citrus aurantium en la copa. Al día siguiente, se preparó una formulación acaricida que contiene un compuesto de la invención (100 ppm) añadiendo una disolución acuosa de Sorpol 355 (fabricado por Toho Kagaku Co., Ltd.) a una disolución de acetona que contiene el compuesto de la invención. Se pulverizaron 4 ml de la formulación acaricida sobre la hoja con una pistola de pulverización ("PB-308 Piece Bon", Olympos, Osaka; 1 kgf/cm²). La hoja se secó al aire, y después se colocó en una cámara termostática (25±2°C, 16L8D). La mortalidad de los ácaros rojos de cítricos hembras adultos se determinó dos días después de la pulverización.

50 En este Ejemplo de Ensayo, los siguientes compuestos de la invención se usaron como compuestos de ensayo: Compuestos Nos. 1a-15 a 1a-19, 1a-28, 1a-45, 1a-51, 1a-62, 1a-70, 1a-75, 1a-76, 1a-99, 1a-100, 1a-106, 1a-108, 1a-127, 1a-173, 1a-174, 1a-200, 1a-201, 1a-203, 1a-206 a 208, 1a-213, 1a-224, 1a-226, 1a-228, 1a-266, 1a-267, 1a-297, 1a-298, 1a-301, y 1f-6. Como resultado, se logró una mortalidad de 100% mediante todos los compuestos de ensayo de la invención.

55 **Ejemplo 4 de Ensayo. Ensayo en ácaros araña de Kanzawa**

Una copa de plástico (nombre comercial: KP-120, fabricada por Konoike Plastic Co., Ltd., Iwata) se llenó con agua del grifo, y se cubrió con una tapa que tiene un corte de entalladura en ella. Sobre la tapa se colocó un trozo de tejido no tejido (4,5 x 5,5 cm) que tiene una ranura de alrededor de 4 cm de longitud, siendo la ranura paralela al lado más largo del tejido a una distancia de 1 cm desde el borde. La porción del tejido de alrededor de 4 cm de longitud y 1 cm de anchura se suspendió dentro de la copa de plástico a través de la entalladura. Se colocó una hoja de frijol rojo (3,5 x 4,5 cm) con la parte trasera boca arriba sobre el tejido no tejido suficientemente empapado. Después, se liberaron 20 ácaros araña de Kanzawa hembras adultos sobre la hoja de frijol rojo en la copa. Al día siguiente, se pulverizaron sobre la hoja con una pistola de pulverización (PB-308 Piece Bon, Olympos, Osaka; 1 kgf/cm²) 4 ml de una formulación acaricida que contiene un compuesto de ensayo (100 ppm), que se preparó según

el Ejemplo 1 de Ensayo. La hoja se secó al aire, y después se colocó en una cámara termostática (25±2°C, 16L8D). La mortalidad de los ácaros araña de Kanzawa hembras adultos se determinó dos días después de la pulverización.

En este Ejemplo de Ensayo, los siguientes compuestos de la invención se usaron como compuestos de ensayo: Compuestos Nos. 1a-17, 1a-70, 1a-76, 1a-108, 1a-200, 1a-201, 1a-206 a 1a-208, 1a-210, 1a-224 a 1a-227, 1a-229, 1a-266, 1a-267, 1a-297, 1a-298 y 1a-301. Como resultado, se logró una mortalidad de 100% mediante todos los compuestos de ensayo de la invención, excepto para el Compuesto No. 1a-210 (mortalidad: 91%).

Ensayo 1 Comparativo. Ensayo en ácaros enroñadores de cítricos

Una copa de plástico (nombre comercial: KP-120, fabricada por Konoike Plastic Co., Ltd., Iwata) se llenó con agua del grifo, y se cubrió con una tapa que tiene un corte de entalladura en ella. Sobre la tapa se colocó un trozo de tejido no tejido (4,5 x 5,5 cm) que tiene una ranura de alrededor de 4 cm de longitud, siendo la ranura paralela al lado más largo del tejido a una distancia de 1 cm desde el borde. La porción del tejido de alrededor de 4 cm de longitud y 1 cm de anchura se suspendió dentro de la copa de plástico a través de la entalladura. Se colocó una hoja de Citrus aurantium (3 cm x 3 cm) con la cara boca arriba sobre el tejido no tejido suficientemente empapado. Para evitar el secado y el escape de los ácaros, la hoja se cubrió con un papel de filtro (diámetro: 5 cm, No. 2, Advante c Toyo Kaisha, Ltd.) que tiene dos orificios de 10 cm de diámetro. Una hoja sobre la que se criaron los ácaros enroñadores de cítricos se cortó en trozos con un sacacorchos (diámetro: 2 mm), y los trozos de hoja se colocaron con la cara boca arriba sobre la hoja de Citrus aurantium sobre el tejido no tejido. Al día siguiente, se retiraron los trozos de hoja secos. Se comprobó el movimiento de los ácaros enroñadores, y se eliminaron los ácaros que sólo mostraron un movimiento ligero en la hora de Citrus aurantium. Posteriormente, se pulverizaron sobre la hoja con una pistola de pulverización (PB-308 Piece Bon, Olympos, Osaka; 1 kgf/cm²) 4 ml de una formulación acaricida que contiene un compuesto de ensayo (100 ppm o 20 ppm), que se preparó según el Ejemplo 1 de Ensayo. La hoja se secó al aire, y después se colocó en una cámara termostática (25 ±2°C, 16L 8D). La mortalidad de los ácaros enroñadores de cítricos se determinó dos días después de la pulverización.

En este Ejemplo de Ensayo, los siguientes compuestos de la invención se usaron como compuestos de ensayo: Compuestos Nos. a-19, 1a-26, 1a-86, 1a-126, y 1e-3. Para comparación, se usó el Compuesto 1-92 (Compuesto A), el Compuesto 2-8 2 (Compuesto B), y el Compuesto 5-9 7 (Compuesto C) descritos en el documento WO 2005/095380 (Documento 1 de Patente).

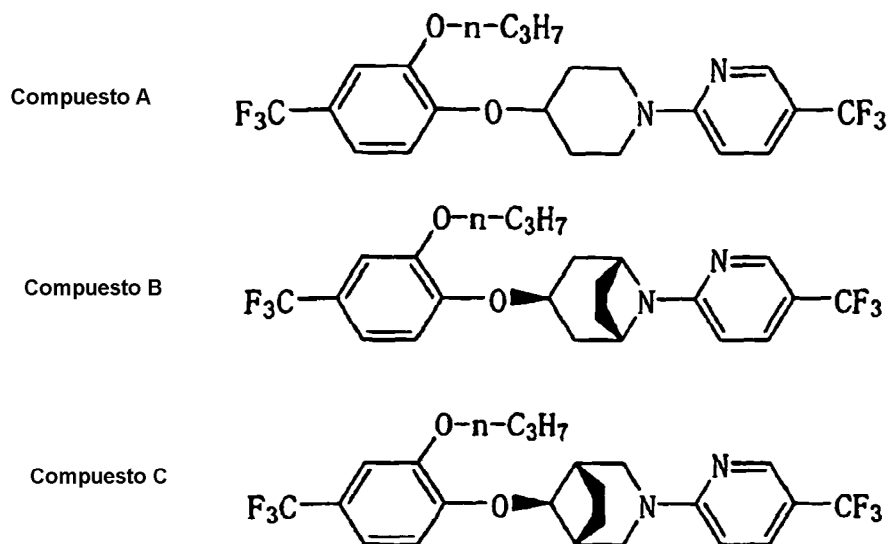
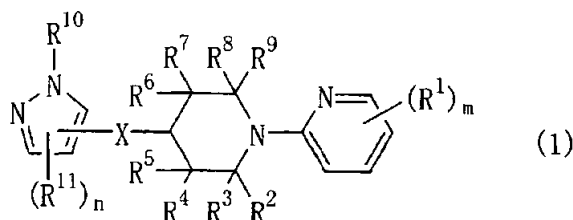


Tabla 67

Compuesto de Ensayo		Mortalidad de insectos (%)	
		100 ppm	20 ppm
Compuesto de la invención	1a-19	100	94
	1a-26	100	67
	1a-86	100	80
	1a-126	100	88
	1e-3	95	75
Compuesto comparativo	Compuesto A	7	0
	Compuesto B	68	0
	Compuesto C	54	0

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



en la que R^1 es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} ;

$R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8,$ y R^9 son cada uno, independientemente, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} ;

cada pareja de R^2 y R^8 , y R^4 y R^6 puede unirse para formar un grupo alqueno de C_{1-4} ;

R^{10} es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo cicloalquilo de C_{3-8} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo alquino de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo haloalqueno de C_{2-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-6} ; un grupo benzoilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4}); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C_{3-8} opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxide de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , benciloxi, fenoxi, $-CON(R^{12})(R^{13})$ (en el que R^{12} y R^{13} son cada uno, independientemente, un grupo alquilo de C_{1-4} , o R^{12} y R^{13} pueden unirse para formar un grupo alqueno de C_{2-7}), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C_{1-4});

R^{11} es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-6} , un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo hidroxialquilo de C_{1-4} , un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-4} , un grupo alquilcarbonilo de C_{1-4} , un grupo mono- o di(alquilo C_{1-4})aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, $-C(R^{14})=NO(R^{15})$ (en el que R^{14} es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C_{1-4} , y R^{15} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C_{1-4} , o un grupo bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-6} , haloalquilo de C_{1-4} , alcoxide de C_{1-6} , haloalcoxi de C_{1-4} , alquiltio de C_{1-4} , ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C_{1-4} , y haloalquilo de C_{1-4});

X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o $-SO_2-$;

m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los R^1 pueden ser iguales o diferentes; y

n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R^{11} pueden ser iguales o diferentes.

2. Compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según la reivindicación 1, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1) en la que R^1 es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C_{1-4} , un grupo ciano, o un grupo nitro.

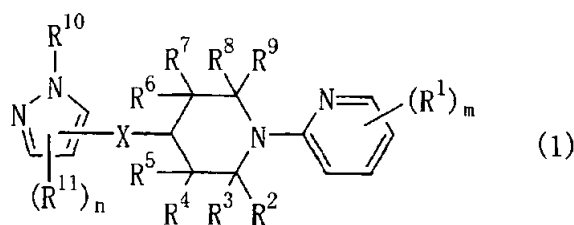
3. Compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según la reivindicación 1 ó 2, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R^{10} es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C_{1-20} ; un grupo alqueno de C_{2-6} ; un grupo haloalquilo de C_{1-6} ; un grupo alquilcarbonilo de C_{1-6} ; un grupo alcóxicarbonilo de C_{1-6} ; un grupo benzoilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno y haloalquilo

de C₁₋₄); u n grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en grupo formilo, alcoxi de C₁₋₆, fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄).

4. Compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según la reivindicación 1, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que R¹¹ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo hidroxialquilo de C₁₋₄, un grupo alcocarbonilo de C₁₋₄, un grupo formilo, -C(R¹⁴)=NO(R¹⁵) (en el que R¹⁴ es un átomo de hidrógeno, y R¹⁵ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₄, alquiltio de C₁₋₄, ciano, y nitro) o grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más átomos de halógeno).

5. Compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según la reivindicación 1, en el que el compuesto de N-piridilpiperidina se representa mediante la Fórmula (1), en la que X es un átomo de oxígeno.

6. Método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



en la que R¹ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcocarbonilo de C₁₋₄;

R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, y R⁹ son cada uno, independientemente, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄;

cada pareja de R² y R⁸, y R⁴ y R⁶ puede unirse para formar un grupo alquileo de C₁₋₄;

R¹⁰ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo cicloalquilo de C₃₋₈; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo alquino de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo haloalqueno de C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo alcocarbonilo de C₁₋₆; un grupo benzilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno); un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C₃₋₈ opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₄, benciloxi, fenoxi, -CON(R¹²)(R¹³) (en el que R¹² y R¹³ son cada uno, independientemente, un grupo alquilo de C₁₋₄, o R¹² y R¹³ pueden unirse para formar un grupo alquileo de C₂₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄);

R¹¹ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo hidroxialquilo de C₁₋₄, un grupo alcocarbonilo de C₁₋₄, un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₄, un grupo mono- o di(alquil C₁₋₄)aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, -C(R¹⁴)=NO(R¹⁵) (en el que R¹⁴ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄, y R¹⁵ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁₋₄, o un grupo bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, alquiltio de C₁₋₄, ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄);

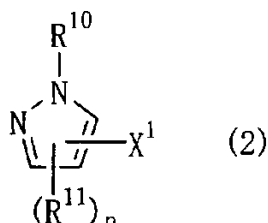
X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o -SO₂-;

m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los m R¹ pueden ser iguales o diferentes;

5

n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R¹¹ pueden ser iguales o diferentes.

comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto pirazólico representado mediante la Fórmula (2)

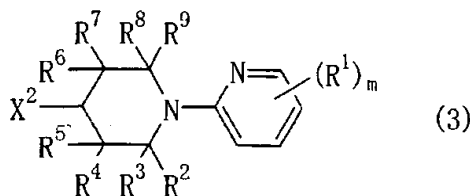


10

en la que R¹⁰, R¹¹, y n son como se definen anteriormente, X¹ es un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, un grupo trifluorometanosulfonilo, un grupo p-toluenosulfonilo, un grupo metililo, un grupo metanosulfonilo, un grupo hidroxilo, o un grupo mercapto

15

con un compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (3)

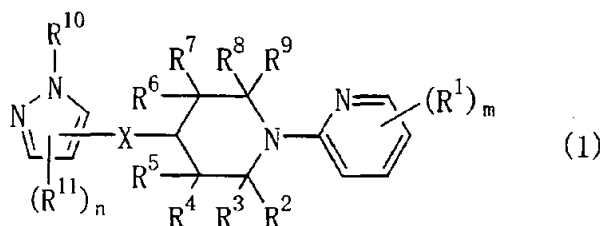


20

en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, y m son como se definen anteriormente, y X² es un grupo hidroxilo o un grupo mercapto.

7. Método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)

25



en la que R¹ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄;

30

R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, y R⁹ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄;

cada pareja de R² y R⁸, y R⁴ y R⁶ puede unirse para formar un grupo alqueno de C₁₋₄;

35

R¹⁰ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo cicloalquilo de C₃₋₈; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo alquino de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo haloalqueno de C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₆; un grupo bencilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno o a cinco átomos de halógeno), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C₃₋₈ sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₄, benciloxi, fenoxi, -CON(R¹²)(R¹³) (en

40

el que R¹² y R¹³ son cada uno independientemente un grupo alquilo de C₁₋₄, o R¹² y R¹³ se pueden unir para formar un grupo alquileo de C₂₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄);

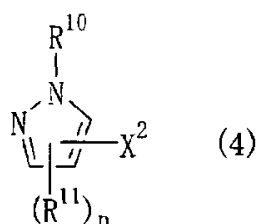
5 R¹¹ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo hidroxialquilo de C₁₋₄, un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄, un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₄, un grupo mono- o di(alquil C₁₋₄)aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, -C(R¹⁴)=NO(R¹⁵) (en la que R¹⁴ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄, y R¹⁵ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁₋₄, o un grupo bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₄, alcóxi de C₁₋₆, haloalcóxi de C₁₋₄, alquiltio de C₁₋₄, ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄);

15 X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o -SO₂-; y

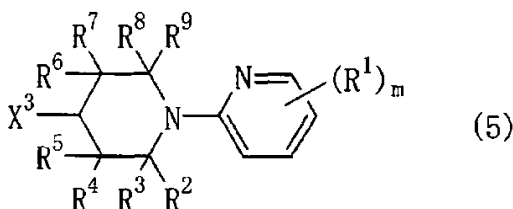
m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los m R¹ pueden ser iguales o diferentes;

20 n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R¹¹ pueden ser iguales o diferentes;

comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto pirazólico representado mediante la Fórmula (4)

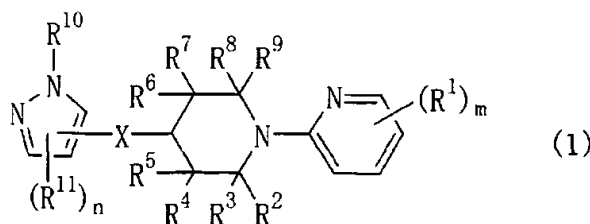


25 en la que R¹⁰, R¹¹, y n son como se definen anteriormente, y X² es un grupo hidroxilo o un grupo mercapto con un compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (5)



30 en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, y m son como se definen anteriormente, y X³ es un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, un grupo trifluorometanosulfonilo, un grupo p-toluenosulfonilo, un grupo metiltio, o un grupo metanosulfonilo.

35 8. Método para producir un compuesto de N-piridilpiperidina, un N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos, estando representado el compuesto de N-piridilpiperidina mediante la Fórmula (1)



40 en la que R¹ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo ciano, un grupo nitro, o un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄;

R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, y R⁹ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C₁₋₄;

cada pareja de R² y R⁸, y R⁴ y R⁶ puede unirse para formar un grupo alqueno de C₁₋₄;

5 R¹⁰ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C₁₋₂₀; un grupo cicloalquilo de C₃₋₈; un grupo alqueno de C₂₋₆; un grupo alquino de C₂₋₆; un grupo haloalquilo de C₁₋₆; un grupo haloalqueno de C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₆; un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₆; un grupo benzilo (opcionalmente sustituido en el grupo fenilo con uno a cinco átomos de halógeno), un grupo fenilo (cada uno opcionalmente sustituido independientemente en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄); un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y grupos heterocíclicos opcionalmente sustituidos); o un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en cicloalquilo de C₃₋₈ opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, formilo, alcoxide de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₄, benciloxi, fenoxi, -CON(R¹²)(R¹³) (en el que R¹² y R¹³ son cada uno independientemente un grupo alquilo de C₁₋₄, y R¹² y R¹³ pueden unirse para formar un grupo alqueno de C₂₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más átomos de halógeno), y grupos heterocíclicos (opcionalmente sustituidos en el anillo heterocíclico con uno o más grupos alquilo de C₁₋₄);

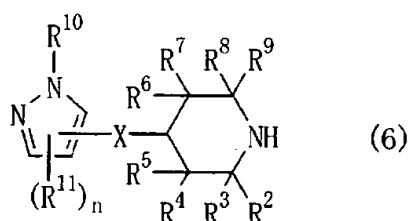
20 R¹¹ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁₋₆, un grupo haloalquilo de C₁₋₄, un grupo hidroxialquilo de C₁₋₄, un grupo alcóxicarbonilo de C₁₋₄, un grupo alquilcarbonilo de C₁₋₄, un grupo mono- o di(alquil C₁₋₄)aminocarbonilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo, -C(R¹⁴)=NO(R¹⁵) (en el que R¹⁴ es hidrógeno o alquilo de C₁₋₄, y R¹⁵ es hidrógeno, alquilo de C₁₋₄, o bencilo), un grupo fenilo (opcionalmente sustituido en el anillo fenílico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₄, alcoxide de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₄, alquiltio de C₁₋₄, ciano, y nitro), o un grupo heterocíclico (opcionalmente sustituido en el anillo heterocíclico con uno o más sustituyentes, seleccionándose cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo de C₁₋₄, y haloalquilo de C₁₋₄);

X es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o -SO₂-;

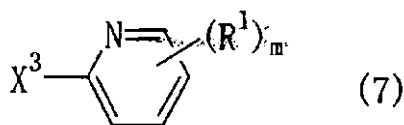
30 m es un número entero de 1 a 4, y cuando m es un número entero de 2 o más, los m R¹ pueden ser iguales o diferentes;

n es un número entero de 1 ó 2, y cuando n es 2, los dos R¹¹ pueden ser iguales o diferentes);

35 comprendiendo el método hacer reaccionar un compuesto piperidínico representado mediante la Fórmula (6)



40 en la que R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, y n son como se definen anteriormente con un compuesto piridínico representado mediante la Fórmula (7)



45 en la que R¹ y m son como se definen anteriormente, y X³ es un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, un grupo trifluorometanosulfonilo, un grupo p-toluenosulfonilo, un grupo metiltio, o un grupo metanosulfonilo.

50 9. Agente de control de plagas que comprende como principio activo el compuesto de N-piridilpiperidina, N-óxido del mismo, o sales de estos compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

10. Agente de control de plagas según la reivindicación 9, que es un acaricida.