

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 389 320**

51 Int. Cl.:
C07D 241/44 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)
A01N 43/66 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08790319 .1**
96 Fecha de presentación: **31.07.2008**
97 Número de publicación de la solicitud: **2174934**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.04.2010**

54 Título: **Derivado de oxopirazina y herbicida**

30 Prioridad:
01.08.2007 JP 2007201387

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
25.10.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
25.10.2012

73 Titular/es:
KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. (50.0%)
4-26, IKENOHATA 1-CHOME
TAITO-KU TOKYO 110-8782, JP y
IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. (50.0%)

72 Inventor/es:
TAMAI, RYUJI;
ITO, MINORU;
KOBAYASHI, MASAMI;
ITSUNARI, TAKASHI y
NAKANO, YUKI

74 Agente/Representante:
CARPINTERO LÓPEZ, Mario

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

ES 2 389 320 T3

DESCRIPCIÓN

Derivado de oxopirazina y herbicida

Campo técnico

5 La presente invención se refiere a un nuevo derivado de oxopirazina o a una de sus sales, un herbicida que contiene el mismo como ingrediente activo y a un procedimiento de uso del mismo.

Técnica anterior

10 Varios compuestos entre los derivados de 1,3-ciclohexanodiona que han sido acilados en la posición 2 con un grupo arilcarbonilo se han encontrado disponibles comercialmente como agroquímicos. Por ejemplo, mesotriona está acaparando la atención pública como herbicida de aplicación foliar para maíz que presenta un nuevo mecanismo de acción. La 1,3-ciclohexanodiona es un tautómero, que existe también como 1-hidroxiciclohexen-3-ona que es una de sus formas de enol, y el presente derivado se ha desarrollado como compuesto para varios usos agroquímicos.

15 Por ejemplo, se ha informado de un derivado que tiene el grupo arilo del grupo arilcarbonilo que sustituye en la posición 2 modificado por varios grupos heteroarilo o cicloalquilo tal como pirazina (véase el Documento de Patente 1), un derivado que tiene el anillo 1,3-ciclohexanodiona condensado en las posiciones 4- y 5- con un anillo de ciclopropano (véase el Documento de Patente 2), un derivado que tiene el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un derivado del grupo pirimidin-5-ilcarbonilo (véase el Documento de Patente 3), un derivado que tiene el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un derivado del grupo pirazin-2-ilcarbonilo (véase el Documento de Patente 4), un derivado que tiene el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un derivado del grupo 1,2,3-tiadiazol-5-ilcarbonilo (véase el Documento de Patente 5), derivados que tienen el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un derivado del grupo piridincarbonilo (véase los Documentos de Patente 2, 6, 7, 8, 9 y 10), derivados que tienen el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un derivado del grupo quinolincarbonilo (véase los Documentos de Patente 11 y 12), un derivado que tiene el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un grupo heteroarilcarbonilo formado a partir de un benzazol (véase el Documento de Patente 13), un derivado que tiene el grupo arilcarbonilo en la posición 2 modificado por un derivado del grupo azolcarbonilo formado a partir de un 1,2-azol (véase el Documento de Patente 14) y similares. Además, también se ha informado de derivados en los cuales la posición 4 y la posición 6 del anillo de 1,3-ciclohexanodiona están reticuladas por un grupo alquileo tal como un grupo etileno (véase los Documentos de Patente 8, 11, 12, 13, 14, 15 y 16). Además, también se ha presentado un anillo 3,5-ciclohexanodiona-1-tiona en el cual la posición 5 del anillo 1,3-ciclohexanodiona ha sido modificada por un grupo oxo, y la posición 1 ha sido modificada por un grupo tiocarbonilo (véase el Documento de Patente 17).

Como tal, se ha informado de un gran número de compuestos de ciclohexanodiona que presentan actividad herbicida, pero no se conoce ningún compuesto de ciclohexanodiona que tenga un anillo dihidropirazina sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo (en la presente memoria descriptiva, esto se puede denominar genéricamente (tio)oxo), tal como el compuesto de la presente invención representado por medio de la fórmula [I] siguiente:

35 Documento de Patente 1: EP-283261
Documento de Patente 2: WO 91/00260
Documento de Patente 3: US 4708732
Documento de Patente 4: DE-3902818
Documento de Patente 5: EP-338525
40 Documento de Patente 6: JP-A Nº. 2-78662
Documento de Patente 7: JP-A Nº. 3-52862
Documento de Patente 8: JP-A Nº. 4-29973
Documento de Patente 9: WO 96/14285
Documento de Patente 10: WO 2000/39094
45 Documento de Patente 11: JP-A Nº. 2000-16982
Documento de Patente 12: WO 2001/14069
Documento de Patente 13: WO 2000/68210
Documento de Patente 14: JP-A Nº. 2005-200401
Documento de Patente 15: WO 2005/058831
50 Documento de Patente 16: WO 2006/066871
Documento de Patente 17: DE 10256354

Divulgación de la invención**Problemas a resolver por la invención**

55 Como se ha comentado anteriormente, se sabe que los compuestos de 1,3-ciclohexanodiona sustituidos con un grupo heteroarilcarbonilo específico presentan actividad herbicida, pero debido a que es necesario aplicar estos compuestos en dosificaciones elevadas, no resultan satisfactorios como herbicidas. De este modo, ha venido existiendo demanda para el desarrollo de un herbicida que muestre propiedades excelentes en dosificaciones bajas.

La presente invención se ha conseguido bajo dichas circunstancias, y un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto que muestre una actividad herbicida que no provoque daños inducidos por el fármaco frente a plantas y cultivos de utilidad, y que pueda controlar el desarrollo de diferentes malas hierbas en terrenos elevados, huertos, arrozales y tierras no agrícolas en dosificaciones reducidas, y un herbicida que contiene el compuesto.

Medios para resolver el problema

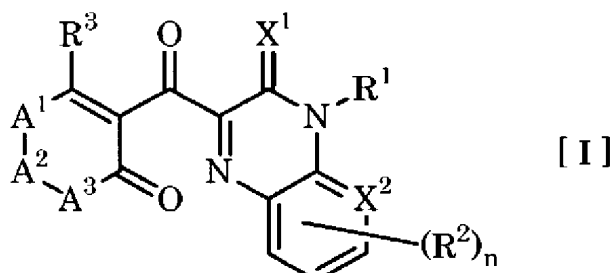
Con el fin de conseguir el fin anteriormente descrito, los inventores de la presente invención han llevado a cabo a conciencia investigación sobre la estructura química y la actividad herbicida de los compuestos de ciclohexanodiona. Como resultado de ello, han encontrado que un compuesto de ciclohexanodiona que presenta un anillo de pirazina sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo puede controlar el desarrollo de varias malas hierbas en terrenos elevados, huertos, arrozales y tierras no agrícolas durante un período largo de tiempo, y exhibe elevada seguridad frente a las plantas y cultivos útiles y similares, completando de este modo la presente invención.

De este modo, la presente invención se caracteriza porque para un compuesto de 2-heteroarilcarbonyl-1,3-ciclohexanodiona que presenta actividad herbicida, se usa como grupo heteroarilo un grupo 2-(tio)oxopirazin-3-ilo que puede estar sustituido y preferentemente un grupo 2-(tio)oxobenzopirazin-3-ilo que puede estar sustituido o un grupo 2-(tio)oxopiridopirazin-3-ilo que puede estar sustituido.

De manera más específica, la presente invención se refiere a los siguientes (1) a (7):

(1) Un derivado de oxopirazina representado por la fórmula [I] o una de sus sales aceptable farmacéuticamente:

[Fórmula Química 1]



en la que X¹ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X² representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²), es decir, CH que puede estar sustituido con un sustituyente R², o N(O)_m;

m representa un número entero de 0 ó 1;

R¹ representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo haloalquino C₂-C₆; un grupo halocicloalquilo C₃-C₈; un grupo halocicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo aminoalquilo C₁-C₆; un grupo nitroalquilo C₁-C₆; un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino alquilo C₁-C₆; un grupo di(alquil C₁-C₆)aminoalquilo C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfinilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆ (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o más de R⁴ idénticos o diferentes), es decir, un fenilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆ en el que el grupo fenilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquiloxi C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆ (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o más de R⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo feniloxialquilo C₁-C₆ en el que el grupo fenilo puede estar sustituido con uno o dos o más radicales de R⁴ diferentes; un grupo heterocicloalquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (un resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁵ idénticos o diferentes), es decir, un grupo heterocicloalquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁵ idénticos o diferentes; un grupo feniltioalquilo C₁-C₆ (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo feniltioalquilo C₁-C₆ en el que el grupo fenilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfinilalquilo C₁-C₆ (un grupo fenilo del

grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^4 idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^4 idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfonilalquilo C_1-C_6 (un fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^4 idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^4 idénticos o diferentes; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^5 idénticos o diferentes), es decir, un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un átomo de nitrógeno, y puede estar sustituido con uno o dos o más de R^5 idénticos o diferentes; un grupo alquilitio C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfinilalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarbonilo C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , un grupo acilo C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo acilamino C_1-C_6 ; un grupo di(alcoxi C_1-C_6)-alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcóxicarbonil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , un grupo alcóxiimino C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilidenaminoxi- C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo ($R^6R^7N-C=O$)alquilo C_1-C_6 ; un grupo aril C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 - (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R^8 idénticos), es decir, un grupo aril C_6-C_{10} alquilo C_1-C_6 en el que el grupo arilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^8 idénticos o diferentes; un grupo alquilo C_1-C_6 heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes), es decir, un grupo alquilo C_1-C_6 heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno, y puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes; un grupo $NR^{10}R^{11}$; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo arilo C_1-C_6 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C_1-C_6 que puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes; o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} idénticos o diferentes), es decir, un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} idénticos o diferentes.

R² representa un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitró; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo haloalquino C₂-C₆; un grupo halocicloalquilo C₃-C₈; un grupo halociclo C₃-C₈ alquilo C₁-C₆ alquilo; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo cicloalcoxi C₃-C₈; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilcarbonilo C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo amino; un grupo mono(alquil C₁-C₆) amino; un grupo di(alquil C₁-C₆) amino; un grupo acilamino C₁-C₆; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoximino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆; un grupo carbamilo; un grupo mono (alquil C₁-C₆) aminocarbonilo; un grupo di(alquil C₁-C₆) aminocarbonilo; o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de oxígeno y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; y además, dos R² adyacentes puede estar unidos a los átomos de carbono respectivos a los cuales se encuentran unidos directamente los R², para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitró, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆ o un grupo oxo; n representa un número entero de 0 a 4 cuando X² es CH (el grupo puede estar sustituido con R²), es decir, cuando X² es CH que puede estar sustituido con un sustituyente R², y n representa un número entero de 0 a 3 cuando X² es N(O)_m;

R³ representa un grupo hidroxilo; O-M⁺ (en el que M⁺ es un catión de metal alcalino o un catión de amonio); un grupo amino; un átomo de halógeno; un grupo alquilsulfoniloxi C₁-C₆; un grupo alquilitio C₁-C₆; un grupo alquilsulfinilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquitio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfinilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alquenilitio C₂-C₆; un grupo alquenilsulfinilo C₂-C₆; un grupo alquenilsulfonilo C₂-C₆; un grupo alquinilitio C₂-C₆; un grupo alquilinsulfinilo C₂-C₆; un grupo alquilinsulfonilo C₂-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆; un grupo alquilencarboniloxi C₂-C₆; un grupo alquilnicarboniloxi C₂-C₆; un grupo fenoxi (el

grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenoxi que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo feniltio (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo feniltio que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilcarbonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilcarbonilo que puede estar sustituido con uno o dos o más R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo 1,2,4-triazol-1-il; un grupo 1,2,3-triazol-1-il; un grupo 1,2,3-triazol-2-il; un grupo imidazol-1-il; un grupo pirazol-1-il; un grupo tetrazol-1-il; o un grupo tetrazol-2-il.

R² representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenoilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₅; un grupo alquenoiloxi C₂-C₆; un grupo alquiniiloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆.

R⁵ representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo nitro, un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquitio C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquitio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆.

R⁶ y R⁷ representan cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆, y además R⁶ y R⁷ pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual éstos se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo puede presentar un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁶ y R⁷.

R⁸ representa un átomo de halógeno; un grupo nitró; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenoilo C₂-C₆; un grupo alquínilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alquenoiloxi C₂-C₆; un grupo alquíniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfínilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfínilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocicarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R⁹ representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo nitro, un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfinilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfinilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocixarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; alquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, o un grupo alcóxicarbonilo C₁-C₆, y además R¹⁰ y R¹¹ pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual éstos se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo puede presentar un átomo de azufre y/o oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R¹⁰ y R¹¹.

R¹² representa un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo halocicloalquilo C₃-C₈; un grupo halocicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆ alquilo; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo cicloalquiloxi C₃-C₈; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquinox C₂-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo amino; un grupo acilamino C₁-C₆; un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino; un grupo di(alquil C₁-C₆)amino; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alcoxi C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxiiimino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆; un grupo carbamilo; un grupo mono (alquil C₁-C₆) aminocarbonilo; un grupo di(alquil C₁-C₆) aminocarbonilo; o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de oxígeno y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes; o un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo

- de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más R^{14} idénticos o diferentes), es decir, un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno y puede estar sustituido con uno o dos o más R^{14} idénticos o diferentes, o dos R^{12} adyacentes pueden estar unidos con los átomos de carbono respectivos a los cuales R^{12} se encuentran unidos directamente para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo haloalcoxi C_1-C_6 o un grupo oxo;
- R^{13} representa un grupo oxi; un grupo tioxi; un grupo hidroxilo, un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenilo C_2-C_6 ; un grupo halocicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo halocicloalquil C_3-C_8 alquilo; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquiloxi C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquiloxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo amino; un grupo mono(alquil C_1-C_6) amino; un grupo di(alquil C_1-C_6) amino; un grupo acilamino C_1-C_6 ; un grupo carboxilo, un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; un grupo carbamoilo; un grupo mono (alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoximino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; y además dos R^{13} adyacentes puede estar unidos junto con los respectivos átomos de carbono a los que R^{13} se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo haloalcoxi C_1-C_6 o un grupo oxo;
- R^{14} representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ;
- A^1 representa $C(R^{15}R^{16})$;
- A^2 representa $C(R^{17}R^{18})$, o $C=O$;
- A^3 representa $C(R^{19}R^{20})$; y
- R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} y R^{20} representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 y R^{15} y R^{20} pueden estar unidos juntos para formar una cadena de alquileo C_2-C_5 y pueden constituir un anillo junto con los átomos de carbono adyacentes.
- (2) El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con (1) anterior, en el que en la fórmula [I], X^2 es CH (el grupo puede estar sustituido con R^2), es decir, CH que puede estar sustituido con un sustituyente R^2 .
- (3) El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con (1) anterior, en el que en la fórmula [I], X^2 es $N(O)_m$.
- (4) El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con la reivindicación 1, en el que en la fórmula [I], R^3 es un grupo hidroxilo; o O^+M^+ (en el que M^+ es un catión de metal alcalino o un catión de amonio).
- (5) El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con (1) anterior, en el que en la fórmula [I],
- X^1 es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
- X^2 es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R^2), es decir, CH puede estar sustituido con un sustituyente R^2 , o un átomo de nitrógeno;
- R^1 representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C_1-C_{12} ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo fenoxialquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo tetrahidrofuranoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquil C_1-C_6 sulfonilalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxialquilo C_1-C_6 ; un grupo acil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo $(R^6R^7N-C=O)$ alquilo C_1-C_6 ; un grupo aril C_6-C_{10} alquilo C_1-C_6 (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^8 idénticos o diferentes), es decir, un grupo aril C_6-C_{10} alquilo C_1-C_6 en el que el grupo arilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^8 idénticos o diferentes; un grupo Het^1 -alquilo C_1-C_6 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes), es decir un grupo Het^1 -alquilo C_1-C_6 que puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes; un grupo $NR^{10}R^{11}$; un grupo arilo C_6-C_{10} (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C_6-C_{10} que puede estar sustituido con uno o dos o más R^{12} idénticos o diferentes; o un grupo Het^1 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más R^{13} idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het^1 que puede estar sustituido con uno o dos o más R^{13} idénticos o diferentes, en el

que Het¹ es tetrahidrofurano, tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol;

R² es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

n representa un número entero de 0 a 4 y X² es CH (el grupo puede estar sustituido con R²), es decir, CH que puede estar sustituido con R², y cuando X² es N(O)_m, n representa un número entero de 0 a 3;

R³ es un grupo hidroxilo;

R⁶ y R⁷ representa cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆;
o R⁶ y R⁷ también pueden estar unidos junto con el nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que este anillo presenta un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁶ y R⁷;

R⁸ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ o un grupo haloalcoxi C₁-C₆;

R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆;

R¹² es un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilenilo C₂-C₆, un grupo alquilenilo C₂-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquiltio C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆, un grupo di(alquil C₁-C₆)amino, o un grupo Het¹-alcoxi C₁-C₆ (Het¹ presenta el mismo significado que se ha definido anteriormente) o dos de R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo oxo; y

R¹³ es un grupo oxo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆; o un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino.

(6) El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con uno cualquiera de (1), (2), (4) y (5) anteriores, en el que en la fórmula [I]

X¹ es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X² es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²), es decir, CH puede estar sustituido con un sustituyente R²;

R¹ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alquilenilo C₂-C₆; un grupo alquilenilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo fenoxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahidrofuranoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarbonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxycarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes), es decir, un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ en el que el grupo arilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes; un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes), es decir un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes; un grupo NR¹⁰R¹¹; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C₆-C₁₀ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes; o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het¹ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes, en el que Het¹ es tetrahidrofurano, tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol;

R² es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

n representa un número entero de 0 a 4;

R³ es un grupo hidroxilo;

R⁶ y R⁷ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆; o R⁶ y R⁷ pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo presenta un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁶ y R⁷;

R⁸ es un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C₁-C₆;

R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆;

R¹² es un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilenilo C₂-C₆, un grupo alquilenilo C₂-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆

alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxicarbonilo C₁-C₆, un grupo di(alquil C₁-C₆)amino, o un grupo Het¹-alcoxi C₁-C₆ (Het¹ presenta el mismo significado que se ha definido anteriormente) o dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo oxo; y R¹³ es un grupo oxo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆; o un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino.

(7) El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con uno cualquiera de (1), (3), (4) y (5) anteriores, en el que en la fórmula [I],

X¹ es un átomo de oxígeno;

X² es un átomo de nitrógeno;

R¹ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxicarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆; (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes), es decir, un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ en el que el grupo arilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes; un grupo Het²-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes), es decir un grupo Het²-alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C₆-C₁₀ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes; o un grupo Het² (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het² que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes; en el que Het² es 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, piridina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol o benzo-1,4-dioxano;

R² es un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆;

n representa un número entero de 0 a 4 en el que X² es CH (el grupo puede estar sustituido con R²), es decir, CH que puede estar sustituido con R², o representa un número entero de 0 a 3 cuando X² es N(O)_m;

R³ es un grupo hidroxilo;

R⁸ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ o un grupo haloalcoxi C₁-C₆;

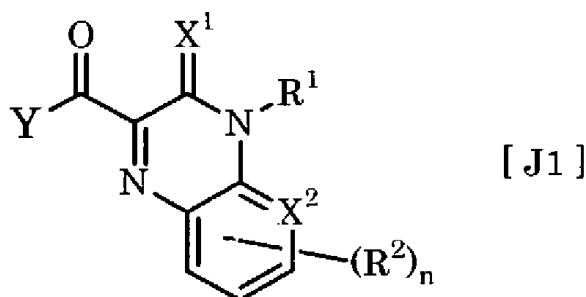
R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo C₁-C₆;

R¹² es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆ haloalquiltio C₁-C₆, o dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno; y

R¹³ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆;

(8) Un compuesto representado por medio de la fórmula [J1]:

[Fórmula Química 2]



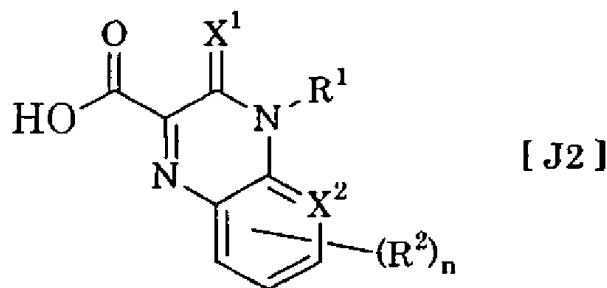
en la que X¹ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X² representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²) o un átomo de nitrógeno;

R¹ representa un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahidrofuranoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-

- C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcocixarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes), es decir, un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ en el que el grupo arilo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes; un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes), es decir un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes; un grupo NR¹⁰R¹¹; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C₆-C₁₀ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes; o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het¹ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes;
- R² representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;
- n representa un número entero de 0 a 4 cuando X² es CH (el grupo puede estar sustituido con R²) y n representa un número entero de 0 a 3 cuando X² es un átomo de nitrógeno;
- R⁶ y R⁷ representa cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ y además R⁶ y R⁷ pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo presenta un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁶ y R⁷;
- R⁸ es un átomo de halógeno; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; o un grupo haloalcoxi C₁-C₆;
- R⁹ representa un grupo alquilo C₁-C₆; un átomo de halógeno; o un grupo haloalquilo C₁-C₆;
- R¹⁰ y R¹¹ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcocixarbonilo C₁-C₆;
- R¹² representa un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alqueniloxi C₂-C₆, un grupo alquiloxi C₂-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquiloxi C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcocixarbonilo C₁-C₆, un grupo di(alquil C₁-C₆)amino, o un grupo Het¹-alcoxi C₁-C₆ y además dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo oxo; y
- R¹³ representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; o un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino;
- Y representa un átomo de halógeno o un grupo ciano; y
- Het¹ representa tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol.
- (9) Un compuesto representado por medio de la fórmula [J2]:

[Fórmula Química 3]



en la que X¹ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X² representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²) o un átomo de nitrógeno;

R¹ representa

- un grupo alquiloxi C₁-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalquenilo C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahydrofuranoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un

grupo alcóxicarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquilo C₁-C₆;

un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes), es decir un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C₆-C₁₀ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes; o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het¹ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes;

R² representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcóxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

n representa un número entero de 0 a 4 cuando X² es CH (el grupo puede estar sustituido con R²) y n representa un número entero de 0 a 3 cuando X² es un átomo de nitrógeno;

R⁶ y R⁷ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ y además R⁶ y R⁷ pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo presenta un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁶ y R⁷;

R⁹ representa un grupo alquilo C₁-C₆; un átomo de halógeno; o un grupo haloalquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcóxicarbonilo C₁-C₆;

R¹² representa un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo alcóxi C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo alcóxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcóxicarbonilo C₁-C₆; un grupo di(alquil C₁-C₆)amino; o un grupo Het¹-alcoxi C₁-C₆ y además dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo oxo; y

R¹³ representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcóxi C₁-C₆; o un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino;

Het¹ representa tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidropirano, dióxido de tetrahidropirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol.

(10) El compuesto de acuerdo con (9) anterior, en el que en la fórmula [2],

R¹ es un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalquenilo C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahidrofuranoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcóxicarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquilo C₁-C₆;

un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes), es decir un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes; un grupo NR¹⁰R¹¹; o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het¹ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes.

(11) El compuesto de acuerdo con (9) anterior, en el que en la fórmula [J2],

X² representa un átomo de nitrógeno, y

R¹ es un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes), es decir, un grupo arilo C₆-C₁₀ que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes.

(12) Un herbicida que se caracteriza por comprender el derivado de oxopirazina de acuerdo con uno cualquiera de (1) a (7) anteriores o una de sus sales, como ingrediente activo.

(13) Un procedimiento para usar el herbicida que se caracteriza por tratar suelos y/o plantas con una cantidad eficaz del herbicida de acuerdo con (12) anterior.

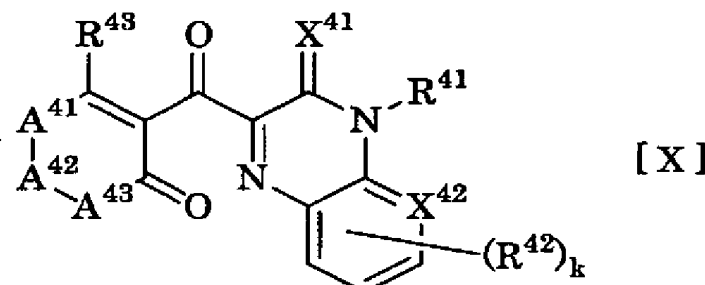
(14) Una composición agroquímica para uso herbicida, que comprende derivados de oxopirazina de acuerdo con uno cualquiera de (1) a (7) anteriores o una de sus sales, y un vehículo aceptable agroquímicamente.

(15) Un procedimiento para evitar el crecimiento de malas hierbas, incluyendo el procedimiento la dispersión de una composición agroquímica que contiene una cantidad eficaz del derivado de oxopirazina de acuerdo con uno de (1) a (7) anteriores o una de sus sales, sobre un lugar en el cual se está produciendo el crecimiento de las malas hierbas objeto de eliminación.

La presente invención también se refiere a los siguientes (16) a (25).

(16) Un derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [X] o una de sus sales aceptables agroquímicamente:

[Fórmula Química 4]



en la que X^{41} representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
 X^{42} representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R^{42}) o N(O)m;
m representa un número entero de 0 ó 1;

R⁴¹ representa un átomo de hidrógeno; un grupo amino, un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino; un grupo di(alquilo C₁-C₆)amino; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₁₂ que puede estar sustituido con cualquier grupo escogido entre el grupo sustituyente α como se muestra a continuación; un grupo cicloalquilo C₃-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente α como se muestra a continuación; un grupo alquinilo C₂-C₆ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente α como se muestra a continuación; un grupo fenilo que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación; un grupo fenilalquilo C₁-C₃ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación; un grupo heterocíclico que presenta de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación); o un grupo heterocíclico de alquilo C₁-C₃ que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación);

R⁴² representa un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₃, un grupo alquenilo C₂-C₆, un grupo alquinilo C₂-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo cicloalquiloxi C₃-C₆, un grupo alqueniloxi C₂-C₆, un grupo alquiniloxi C₂-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquilitio C₁-C₆, un grupo alquilsulfinito C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquilitio C₁-C₆, un grupo haloalquilsulfinito C₁-C₆, un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo amino, un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino, un grupo di(alquil C₁-C₆)amino, un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo carboxilo, un grupo alcóxicarbonilo C₁-C₆, un grupo mono(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo o un grupo di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo:

X^{42} representa un número entero de 0 a 4 cuando X^{42} es CH (el grupo puede estar sustituido con R^{42}) o n representa un número entero de 0 a 3 cuando X^{42} es N(O)_m;

R⁺³ representa un grupo hidroxilo, O⁻M⁺ (en el que M⁺ es un catión de metal alcalino o un catión de amonio), un grupo amino, un átomo de halógeno, un grupo alquilsulfoniloxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfnilo C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquitio C₁-C₆, un grupo haloalquilsulfnilo C₁-C₆, un grupo haloalquilsulfonilo, un grupo alqueniltio C₁-C₆, un grupo alqueniltio C₁-C₆, un grupo alquenilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alquiniltio C₁-C₆, un grupo alquinilsulfnilo C₁-C₆, un grupo alquinilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆, un grupo alquenilcarboniloxi C₁-C₆, un grupo alquilcarbarniloxi C₁-C₆, un grupo fenoxi que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente γ como se muestra a continuación, un grupo feniltio que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente γ como se muestra a continuación, un grupo fenisulfnilo que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente γ como se muestra a continuación, un grupo fenisulfonilo que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente γ como se muestra a continuación, un grupo fenisulfoniloxi que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente γ como se muestra a continuación, un grupo fenilcarboniloxi que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente γ como se muestra a continuación, un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-2-ilo, un grupo imidazol-1-ilo, un grupo pirazol-1-ilo, un grupo tetrazol-1-ilo o un grupo tetrazol-2-ilo;

A^{41} representa $C(R^{44}R+)$;

A^{42} representa $(CR^{46}R^{47})$ ó $C=O$:

A^{43} representa $C(R^{48}R^{49})$; y

R^{44} , R^{45} , R^{46} , R^{47} , R^{48} y R^{49} representan cada uno un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1 - C_6 , o R^{44} y R^{49} pueden unirse por medio de una cadena de alquileo C_2 - C_5 para constituir un anillo.

[Grupo sustituyente α]

Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo fenoxi, un grupo alquilcarbonilo C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfinilo C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo amino, un grupo mono (alquil C₁-C₆) amino, un grupo di(alquil C₁-C₆) amino, un grupo alcoxi C₁-C₆ - alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₆ que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen de forma arbitraria entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆ y un grupo R⁵⁰R⁵¹N-C=O (R⁵⁰ y R⁵¹ representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆, o R⁵⁰ y R⁵¹ se pueden unir con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 o 6 miembros, mientras que este anillo puede tener uno o más átomos que se escogen de forma arbitraria entre el grupo de un átomo de oxígeno, un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre, interpuestos en el interior del mismo, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁵⁰ y R⁵¹).

15 [Grupo sustituyente β]

Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₆, un grupo alqueno C₂-C₆, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo alqueno C₂-C₆, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo alquilcarbonilo C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfinilo C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquiltio C₁-C₆, un grupo haloalquilsulfinilo C₁-C₆, un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo amino, un grupo mono(alquil C₁-C₆) amino, un grupo di(alquil C₁-C₆) amino, un grupo alcoxi C₁-C₃ alquilo C₁-C₃, un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆, un grupo oxo cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₃, un grupo cianoalcoxi C₁-C₃, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo carboxilo, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo mono (alquil C₁-C₁₀) aminocarbonilo, un grupo di(alquil C₁-C₁₀) aminocarbonilo y un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₃ que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos de forma arbitraria entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno;

[Grupo sustituyente γ]

Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, y un grupo haloalcoxi C₁-C₆.

(17) El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con (11) anterior, en el que en la fórmula [X], X⁴² es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R⁴²).

(18) El derivado de oxopirazina o sus sal aceptable farmacéuticamente de acuerdo con (11) anterior, en el que en la fórmula [X], X⁴² es N(O)_m.

35 (19) El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con (16) a (18) anteriores, en el que en la fórmula [X],

X⁴¹ es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X⁴² es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R⁴²) o un átomo de nitrógeno;

40 R⁴¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₁₂ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente α como se muestra a continuación, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo alqueno C₂-C₆, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo fenilo que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación, un grupo fenilalquilo C₁-C₃ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación, un grupo heterocíclico que se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente β como se muestra a continuación), o un grupo alquilo C₁-C₃ heterocíclico en el que el resto heterocíclico se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación);

R⁴² es un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, o un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆;

50 n es un número entero de 0 a 4 cuando X⁴² es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R₄₂) o n es un número entero de 0 a 3 cuando X⁴² es un átomo de nitrógeno; y
R⁴³ es un grupo hidroxilo.

[Grupo sustituyente α]

55 Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ - alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo fenoxi, un grupo alquilcarbonilo C₁-C₆, un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfinilo C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆ y un grupo R⁵⁰R⁵¹N-C=O (R⁵⁰ y R⁵¹

representan cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆, o R⁵⁰ y R⁵¹ se pueden unir con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 o 6 miembros, mientras que este anillo puede tener un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁵⁰ y R⁵¹).

[Grupo sustituyente β]

- 5 Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alqueniilo C₂-C₆, un grupo alquiniilo C₂-C₆, un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₃ alquilo C₁-C₃, un grupo cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₃, un grupo cianoalcoxi C₁-C₃ y un grupo acilo C₁-C₆.

[Grupo Z de anillo heterocíclico]

Un grupo que comprende tetrahydrofurano, tetrahydrotiofeno, dióxido de tetrahydrotiofeno, tetrahydrotiopirano, dióxido de tetrahydrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-oxadiazol, piridina, pirimidina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol y benzo-1,4-dioxano.

- 15 (20) El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con uno cualquiera de (16) a (19) anteriores, en el que en la fórmula [X],
 X⁴¹ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,
 X⁴² es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R⁴²);
 R⁴¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₁₂ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre
 20 el grupo sustituyente α como se muestra a continuación, un grupo cicloalquilo C₃-C₆, un grupo alqueniilo C₂-C₆, un grupo alquiniilo C₂-C₆, un grupo fenilo que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación, un grupo fenilalquilo C₁-C₃ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación, un grupo heterocíclico que se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente β como se muestra a continuación), o un grupo alquilo C₁-C₃ heterocíclico en el que el resto heterocíclico se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β como se muestra a continuación);
 R⁴² es un átomo de halógeno, un grupo alquiltio C₁-C₆, o un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆;
 30 n es un número entero de 0 a 4; y
 R⁴³ es un grupo hidroxilo.

[Grupo sustituyente α]

- 35 Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ - alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo fenoxi, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquilcarbonilo C₁-C₆, un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₁₀ en el que el resto heterocíclico se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico siguiente, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆ y un grupo R⁵⁰R⁵¹N-C=O (R⁵⁰ y R⁵¹ representan cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆, y R⁵⁰ y R⁵¹ se pueden unir con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 o 6 miembros, mientras que este anillo puede tener un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁵⁰ y R⁵¹).

[Grupo sustituyente β]

- 45 Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo heterocíclico alcoxi C₁-C₁₀ en el que el resto heterocíclico se escoge entre el grupo Z de anillo heterocíclico como se muestra a continuación, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₃, un grupo cianoalcoxi C₁-C₃ y un grupo acilo C₁-C₆.

[Grupo Z de anillo heterocíclico]

- 50 Un grupo que comprende tetrahydrofurano, tetrahydrotiofeno, dióxido de tetrahydrotiofeno, tetrahydrotiopirano, dióxido de tetrahydrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-oxadiazol, piridina, pirimidina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol y benzo-1,4-dioxano.

- (21) El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con uno cualquiera de (16) a (20) anteriores, en el que la fórmula [X],
 X⁴¹ representa un átomo de oxígeno,
 X⁴² es un átomo de nitrógeno;
 55 R⁴¹ es un grupo alquilo C₁-C₁₂ que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente α

- siguiente, un grupo alqueno C_2-C_6 , un grupo alquino C_2-C_6 , un grupo fenilo que puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β siguiente, un grupo fenilalquilo C_1-C_3 , un grupo heterocíclico que se escoge entre el grupo Z heterocíclico siguiente (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo de sustituyente β siguiente), o un grupo alquilo C_1-C_3 heterocíclico que se escoge entre el grupo Z heterocíclico siguiente (el grupo puede estar sustituido con un grupo que se escoge entre el grupo sustituyente β siguiente);
- 5 R^{42} es un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C_1-C_6 ;
 n es un número entero de 0 a 3;
 R^{43} es un grupo hidroxilo;
- 10 A^{41} es CHR^{44} ;
 A^{42} es CH_2 ;
 A^{43} es CHR^{49}
 R^{44} y R^{49} son átomos de hidrógeno, o R^{44} y R^{49} se pueden unir por medio de una cadena de alqueno C_2-C_5 para constituir un anillo.
- 15 [Grupo sustituyente α]
 Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C_1-C_6 y un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 .
 [Grupo sustituyente β]
 Un grupo que comprende un átomo de halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 y un grupo alcoxi C_1-C_6 .
- 20 [Grupo Z de anillo heterocíclico]
 Un grupo que comprende 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, isoxazol, piridina, pirimidina, 1,3-benzodioxol y benzo-1,4-dioxano.
- (22) Un herbicida que se caracteriza por comprender el derivado de oxopirazina de acuerdo con uno de (16) a (21) anteriores o una de sus sales, como ingrediente activo.
- 25 (23) Un procedimiento de uso de un herbicida que se caracteriza por tratar un suelo y/o plantas con una cantidad eficaz del herbicida de acuerdo con (22) anterior.
- (24) Una composición agroquímica para uso herbicida, que comprende el derivado de oxopirazina de acuerdo con uno cualquiera de (16) a (21) anteriores o una de sus sales, y uno de sus vehículos aceptables farmacéuticamente.
- 30 (25) Un procedimiento para evitar el crecimiento de malas hierbas, incluyendo el procedimiento dispersar una composición agroquímica que contiene una cantidad eficaz del derivado de oxopirazina de acuerdo con uno cualquiera de (16) a (21) anteriores o uno de sus sales, sobre un lugar en el que están creciendo las malas hierbas objeto de eliminación.
- El derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [I] o una de sus sales de acuerdo con la presente invención han sido re-escritos sobre la base de la memoria descriptiva del derivado de oxopirazina representado por
- 35 medio de la fórmula [X] o una de sus sales.
- En la presente memoria descriptiva, todas las materias descritas en la memoria descriptiva de la Solicitud de Patente Japonesa Nº. 2007-201387, sobre la base de la cual la presente solicitud de patente reivindica prioridad, han sido incorporadas en la presente memoria descriptiva de la presente solicitud.

Efecto de la invención

- 40 El derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [I] o una de sus sales aceptables farmacéuticamente de acuerdo con la presente invención pueden controlar el crecimiento de varias malas hierbas en terrenos elevados, huertos, arrozales y terrenos no agrícolas, y presenta efectos excelentes de acción como agroquímico, tal como mostrar elevada seguridad frente a las plantas y cultivos de utilidad y similares.

Mejora modo de llevar a cabo la invención

- 45 Se explican los símbolos y términos descritos en la presente memoria descriptiva.
- El átomo de halógeno es un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.
- Una anotación elemental que muestra símbolos elementales y números de subíndice, tales como en C_1-C_3 , indica que el número de elementos del grupo descritos posteriormente a la anotación se encuentra en el intervalo indicado por los números de subíndice. Por ejemplo, en este caso, se indica que el número de carbonos es de 1 a 3. La
- 50 anotación de C_1-C_6 indica que el número de carbonos es de 1 a 6, mientras que la anotación de C_1-C_{12} indica que el número de carbonos es de 1 a 12.
- El grupo alquilo C_1-C_6 representa, a menos que se encuentra particularmente limitado, un grupo alquilo de cadena

lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, y se pueden incluir por ejemplo grupos tales como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, neopentilo, n-hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo. Se puede ejemplificar un grupo alquilo preferido que tiene de 1 a 6 átomos de carbono por medio de un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4, o de 1 a 3 átomos de carbono.

El grupo alquilo C₁-C₁₂ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 12 átomos de carbono, y además de los ejemplos del grupo alquilo C₁-C₆, se pueden incluir por ejemplo grupos n-heptilo, 1-metilhexilo, 5-metilhexilo, 1,1-dimetilpentilo, 2,2-dimetilpentilo, 4,4-dimetilpentilo, 1-etilpentilo, 2-etilpentilo, 1,1,3-trimetilbutilo, 1,2,2-trimetilbutilo, 1,3,3-trimetilbutilo, 2,2,3-trimetilbutilo, 2,3,3-trimetilbutilo, 1-propilbutilo, 1,1,2,2-tetrametilpropilo, n-octilo, 1-metilheptilo, 3-metilheptilo, 6-metilheptilo, 2-etilhexilo, 5,5-dimetilhexilo, 2,4,4-trimetilpentilo, 1-etil-1-metilpentilo, nonilo, 1-metiloctilo, 2-metiloctilo, 3-metiloctilo, 7-metiloctilo, 1-etilheptilo, 1,1-dimetilheptilo, 6,6-dimetilheptilo, decilo, 1-metilnonilo, 2-metilnonilo, 6-metilnonilo, 1-etiloctilo, 1-propilheptilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo. También se puede ejemplificar un grupo alquilo preferido que tiene de 1 a 12 átomos de carbono por medio de un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 8, de 1 a 6 o de 1 a 3 átomos de carbono.

El grupo cicloalquilo C₃-C₈ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono y se pueden incluir, por ejemplo, grupos tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Un grupo cicloalquilo preferido que tiene de 3 a 8 átomos de carbono se puede ejemplificar por medio de un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 6, o de 4 a 6, átomos de carbono. El grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, sustituidos con un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono, en los que el resto cicloalquilo y el resto alquilo respectivamente presentan los mismos significados que se han definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como ciclopropilmetilo, 1-ciclopropiletilo, 2-ciclopropiletilo, 1-ciclopropilpropilo, 2-ciclopropilpropilo, 3-ciclopropilpropilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo.

El grupo haloalquilo C₁-C₆ representa un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 16 átomos de carbono sustituidos con uno o más, preferentemente de 1 a 10, y más preferentemente de 1 a 5, átomos de halógeno, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, fluometilo, clorometilo, bromometilo, difluorometilo, diclorometilo, trifluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, bromodifluorometilo, 2-fluoroetilo, 1-cloroetilo, 2-cloroetilo, 1-bromoetilo, 2-bromoetilo, 2,2-difluoroetilo, 1,2-dicloroetilo, 2,2-dicloroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 1,1,2,2-tetrafluorometilo, pentafluoroetilo, 2-bromo-2-cloroetilo, 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloropropilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2-bromopropilo, 3-bromopropilo, 2-bromo-1-metiletil, 3-yodopropil, 2,3-dicloropropil, 2,3-dibromopropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3,3-tricloropropilo, 3-bromo-3,3-difluoropropilo, 3,3-dicloro-3-fluoropropilo, 2,2,3,3-tetrafluoropropilo, 1-bromo-3,3,3-trifluoropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletilo, heptafluoropropilo, 1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometiletilo, 2,3-dicloro-1,1,2,3,3-pentafluoropropilo, 2-clorobutilo, 3-clorobutilo, 4-clorobutilo, 2-cloro-1,1-dimetiletilo, 4-bromobutilo, 3-bromo-2-metilpropilo, 2-bromo-1,1-dimetiletilo, 2,2-dicloro-1,1-dimetilo, 2-cloro-1-clorometil-2-metiletilo, 4,4,4-trifluorobutilo, 3,3,3-trifluoro-1-metilpropilo, 3,3,3-trifluoro-2-metilpropilo, 2,3,4-triclorobutilo, 2,2,2-tricloro-1,1-dimetiletilo, 4-cloro-4,4-difluorobutilo, 4,4-dicloro-4-fluorobutilo, 4-bromo-4,4-difluorobutilo, 2,4-dibromo-4,4-difluorobutilo, 3,4-dicloro-3,4,4-trifluorobutilo, 3,3-dicloro-4,4,4-trifluorobutilo, 4-bromo-3,3,4,4-tetrafluorobutilo, 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluorobutilo, 2,2,3,3,4,4-hexafluorobutilo, 2,2,3,4,4,4-hexafluorobutilo, 2,2,2-trifluoro-1-metil-trifluorometiletilo, 3,3,3-trifluoro-2-trifluorometilpropilo, 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutilo, 2,3,3,3-tetrafluoro-2-trifluorometilpropilo, 1,1,2,2,2,4,4-octafluorobutilo, nonafluorobutilo, 4-cloro-1,1,2,2,3,3,4,4-octafluorobutilo, 5-fluoropentilo, 5-cloropentilo, 5,5-difluoropentilo, 5,5-dicloropentilo, 5,5,5-trifluoropentilo, 6,6,6-trifluorohexilo y 5,5,5,6,6,6-hexafluorohexilo.

El grupo alqueno C₂-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alqueno de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, vinilo, 1-propenilo, isopropenilo, 2-propenilo, 1-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-butenilo, 1-metil-2-propenilo, 3-butenilo, 2-metil-1-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 1-etil-2-propenilo, 2-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 3-pentenilo, 1-metil-2-butenilo, 4-pentenilo, 1-metil-3-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,3-pentadienilo, 1-vinil-2-propenilo, 1-hexenilo, 1-propil-2-propenilo, 2-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 1-etil-2-butenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-4-pentenilo, 1-etil-3-butenilo, 1-(isobutil)vinilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo, 1-(isopropil)-2-propenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1,5-hexadienilo, 1-vinil-3-butenilo y 2,4-hexadienilo. Se puede ejemplificar un grupo alqueno preferido que tiene de 2 a 6 átomos de carbono por medio de un grupo alqueno de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 4 átomos de carbono.

El grupo alquino C₂-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquino de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-pentinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-etil-2-

- propinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 4-pentinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1-hexinilo, 1-(n-propil)-2-propinilo, 2-hexinilo, 1-etil-2-butinilo, 3-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 5-hexinilo, 1-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo, 1-(isopropil)-2-propinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo y 2,2-dimetil-3-butinilo. Se puede ejemplificar un grupo alquinilo preferido que tiene de 2 a 6 átomos de carbono por medio de un grupo alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 4 átomos de carbono.
- El grupo alcoxi C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, pentiloxi y hexiloxi. Se puede ejemplificar un grupo alcoxi preferido que tiene de 1 a 6 átomos de carbono por medio de un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4, o de 1 a 3 átomos de carbono.
- El grupo alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto alcoxi respectivamente tiene los mismos significados que se han definidos anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metoximetilo, etoximetilo, isopropoximetilo, pentiloximetilo, metoxietilo y butoxietilo.
- El grupo alcoxi C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 representa un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alcoxi tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metoximetoxi, etoximetoxi, 2-metoxietoxi y 2-etoxietoxi.
- El grupo cicloalquilo C_3-C_8 -alquilo C_1-C_6 representa un grupo (alquil)-O- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono, en el que el resto cicloalquilo y el resto alquilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, ciclopropilmetiloxi, ciclopropiletiloxi y ciclopentilmetiloxi. Se puede ejemplificar un grupo cicloalquilo preferido que tiene de 3 a 8 átomos de carbono por medio de un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 6 átomos de carbono.
- El grupo cianoalcoxi C_1-C_6 representa un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo ciano, y en el que el resto alcoxi tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-cianoetoxi y 3-cianopropoxi.
- El grupo cicloalquilo C_3-C_8 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo (cicloalquil)-O- que tiene de 3 a 8 átomos de carbono en el que el resto cicloalquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi y ciclohexiloxi.
- El grupo alqueno C_2-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo (alquenoil)-O- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquenoil tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-propeniloxi.
- El grupo alquino C_2-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo (alquinoil)-O- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquinoil tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-propiniloxi.
- El grupo alquiltio C_1-C_6 representa un grupo (alquil)-S- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metiltio, etiltio, n-propiltio e isopropiltio.
- El grupo alquilsulfinilo C_1-C_6 representa un grupo (alquil)-SO- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n-propilsulfinilo e isopropilsulfinilo.
- El grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 representa un grupo (alquil)-SO₂- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo e isopropilsulfonilo.
- El grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 representa un grupo (alquil)-SO₂-O que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilsulfonilo y etilsulfonilo.
- El grupo alquilsulfonil C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 representa un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo alquilsulfonilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilsulfonilo y el resto alcoxi tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-(metilsulfonil)etoxi y 2-(etilsulfonil)etoxi.

- El grupo mono(alquil C₁-C₆)amino representa un grupo (alquil)-NH- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilamino y etilamino.
- 5 El grupo di(alquil C₁-C₆)amino representa un grupo (alquil)₂-N- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, dimetilamino, dietilamino, metiletilamino, dipropilamino y dibutilamino.
- El grupo mono(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo representa un grupo (alquil)-NH-C(=O)- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilaminocarbonilo y etilaminocarbonilo.
- 10 El grupo di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo representa un grupo (alquil)₂-NH-C(=O)- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, metiletilaminocarbonilo, dipropilaminocarbonilo y dibutilaminocarbonilo.
- 15 El grupo alcóxicarbonilo C₁-C₆ representa un grupo (alquil)-OC(=O)- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metóxicarbonilo, etóxicarbonilo, n-propóxicarbonilo e isopropóxicarbonilo.
- El grupo acilo C₁-C₆ representa un grupo acilo procedente de un ácido carboxílico alifático de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, formilo, acetilo, propionilo, isopropionilo, butirilo y pivaloilo.
- 20 El grupo alquilcarbonilo C₁-C₆ representa un grupo (alquil)-C(=O)-O- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, acetoxi, propioniloxi, isopropioniloxi y pivaloiloxi.
- El grupo alquenilcarbonilo C₂-C₆ representa un grupo (alquenil)-C(=O)-O- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 1-propenilcarbonilo, 2-propenilcarbonilo, 1-butenilcarbonilo y 1-metil-1-propenilcarbonilo.
- 25 El grupo alquilcarbonilo C₂-C₆ representa un grupo (alquil)-C(=O)-O- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 1-propenilcarbonilo y 2-propenilcarbonilo.
- El grupo haloalquiltio C₁-C₆ representa un grupo (haloalquil)-S- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto haloalquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, difluorometiltio y trifluorometiltio.
- 30 El grupo haloalquilsulfino C₁-C₆ representa un grupo (haloalquil)-SO- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto haloalquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, clorometilsulfino, difluorometilsulfino y trifluorometilsulfino.
- 35 El grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆ representa un grupo (haloalquil)-SO₂- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto haloalquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, clorometilsulfonilo, difluorometilsulfonilo y trifluorometilsulfonilo.
- El grupo mono(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo representa un grupo (alquil)-NH-C(=O)- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilaminocarbonilo y etilaminocarbonilo.
- 40 El grupo di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo representa un grupo (alquil)₂-NH-C(=O)- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, metiletilaminocarbonilo, dipropilaminocarbonilo y dibutilaminocarbonilo.
- 45 El grupo alquenioltio C₂-C₆ representa un grupo (alquenil)-S- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquenioltio tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, aliltio.
- El grupo alqueniolsulfino C₂-C₆ representa un grupo (alquenil)-SO- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquenioltio tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, alilsulfino.
- 50 El grupo alqueniolsulfonilo C₂-C₆ representa un grupo (alquenil)-SO₂- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquenioltio tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, alilsulfonilo.

El grupo alquinil C₂-C₆ representa un grupo (alquinil)-S- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquinilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-propinil.

- 5 El grupo alquinilsulfinilo C₂-C₆ representa un grupo (alquinil)-SO- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquinilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-propinilsulfinilo.

El grupo alquinilsulfonilo C₂-C₆ representa un grupo (alquinil)-SO₂- que tiene de 2 a 6 átomos de carbono en el que el resto alquinilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-propinilsulfonilo.

- 10 El grupo fenilalquilo C₁-C₆ representa un grupo alquilo que tiene de 2 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo fenilo, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, bencilo, 1-feniletilo y 2-feniletilo.

- 15 El grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo monovalente formado a partir de un anillo heterocíclico policíclico o condensado, monocíclico de 3 a 8 miembros, preferentemente de 5 a 7 miembros, que tiene de 1 a 5, y preferentemente de 1 a 3, heteroátomos escogidos entre el grupo que consiste en un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, oxirano, tetrahidrofurano, pirrolidina, tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, piperidina, piperazina, morfolina, furano, tiofeno, pirrol, pirazol, imidazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,3,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, 1,3,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,3-oxadiazol, 1,2,3-tiadiazol, 1,2,3-triazol, tetrazol, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, 1,3,5-triazina, 1,2,4-triazina, benzotiofeno, benzofurano, indol, benzoxazol, benzotiazol, bencimidazol, bencisoxazol, bencisotiazol, indazol, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano y 2,3-dihydrobenzofurano.

- 25 El grupo heterocíclico-alquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo heterocíclico en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, (tetrahidrofuran-2-il)metilo, (4,5-dihidroisoxazol-5-il)metilo, (isoxazol-5-il)metilo y (tiofen-2-il)metilo.

- 35 El grupo heterocíclico-alcoxi C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, en el que el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y el resto alcoxi respectivamente tienen los mismos significados que se han definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, (tetrahidrofuran-2-il)metoxi y (tetrahidrofuran-3-il)metoxi.

- 40 El grupo heterocíclico-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, representa un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, que está sustituido con un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y el resto alcoxi y el resto alquilo respectivamente tienen los mismos significados que se han definido anteriormente. Se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, (tetrahidrofuran-2-il)metoximetilo y (tetrahidrofuran-3-il)metoximetilo.

- 50 El grupo haloalqueno C₂-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alqueno de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono sustituidos con 1 a 11, y preferentemente de 1 a 5, átomos de halógeno, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-clorovinilo, 2-bromovinilo, 2-yodovinilo, 3-cloro-propenilo, 3-bromo-2-propenilo, 1-clorometilvinilo, 2-bromo-1-metilvinilo, 1-trifluorometilvinilo, 3,3,3-tricloro-1-propenilo, 3-bromo-3,3-difluoro-1-propenilo, 2,3,3,3-tetracloro-1-propenilo, 1-trifluorometil-2,2-difluorovinilo, 2-cloro-2-propenilo, 3,3-difluoro-2-propenilo, 2,3,3-tricloro-2-propenilo, 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-butenilo, 1-bromometil-2-propenilo, 3-cloro-2-butenilo, 4,4,4-trifluoro-2-butenil-4-bromo-4,4-difluoro-2-butenilo, 3-bromo-3-butenilo, 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, 3,4,4-tribromo-3-butenilo, 3-bromo-2-metil-2-propenilo, 3,3-difluoro-2-metil-2-propenilo, 3,3,3-trifluoro-2-metil-propenilo, 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, 3,3,3-trifluoro-1-metil-1-propenilo, 3,4,4-trifluoro-1,3-butadienilo, 3,4-dibromo-1-pentenilo, 4,4-difluoro-3-metil-3-butenilo, 3,3,4,4,5,5,5-heptafluoro-1-pentenilo, 5,5-difluoro-4-pentenilo, 4,5,5-trifluoro-4-pentenilo, 3,4,4,4-tetrafluoro-3-trifluorometil-1-butenilo, 4,4,4-trifluorometil-3-metil-2-butenil, 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadienilo, 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexenilo, 3,4,5,5,5,5-hexafluoro-3-

trifluorometil-1-pentenilo, 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo y 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo.

5 El grupo haloalquinilo C₂-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono sustituidos con 1 a 4 átomos de halógeno idénticos o diferentes y se pueden incluir grupos tales, como por ejemplo, 3-cloro-2-propinilo, 3-bromo-2-propinilo, 3-yodo-2-propinilo, 3-cloro-1-propinilo y 5-cloro-4-pentenilo.

10 El grupo aminoalquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con un grupo amino, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-aminoetilo y 3-aminopropilo.

El grupo mono(alquil C₁-C₆)aminoalquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo amino que está monosustituido con un grupo alquilo, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-(metilamino)etilo y 3-(metilamino)propilo.

15 El grupo di(alquil C₁-C₆)aminoalquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo amino que está disustituido con grupos alquilo, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilaminometilo y N,N-dimetilaminoetilo.

20 El grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alquiltio que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto alquilo del alquiltio tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metiltiometilo y etiletiometilo.

25 El grupo alquilsulfinil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alquilsulfinilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto alquilo del alquilsulfinilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, etilsulfinilmetilo.

30 El grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alquilsulfonilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto alquilo del alquilsulfonilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilsulfonilmetilo y etilsulfonilmetilo.

35 El grupo haloalquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (haloalquil)-S- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto haloalquilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, difluorometiltiometilo y trifluorometiltiometilo.

40 El grupo haloalquilsulfinil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (haloalquil)-SO- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto haloalquilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, difluorometilsulfinilmetilo y trifluorometilsulfinilmetilo.

45 El grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (haloalquil)-SO₂- que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto haloalquilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, difluorometilsulfonilmetilo y trifluorometilsulfonilmetilo.

50 El grupo fenilalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con un grupo fenilo, en el que el resto alquilo y el resto alcoxi tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, benciloximetilo y benciloxietilo.

55 El grupo alcoxi C₁-C₅-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto alcoxi tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-(2-metoxietoxi)etilo y 2-(2-etoxietoxi)etilo.

- 5 El grupo cicloalquilo C_3 - C_8 -alquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (cicloalquil)-O- que tiene de 3 a 8 átomos de carbono, en el que el resto alquilo y el resto cicloalquilo tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, ciclopropiloximetilo, ciclobutiloximetilo, ciclopentiloximetilo y ciclohexiloximetilo.
- 10 El grupo feniloxialquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos sustituido con un grupo (fenil)-O-, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-fenoxietilo y 3-fenoxipropilo.
- 15 El grupo feniltioalquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos sustituido con un grupo (fenil)-S-, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-feniltioetilo y 3-feniltiopropilo.
- 20 El grupo haloalcoxi C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquil-O de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 13, y preferentemente de 1 a 5, átomos de halógeno idénticos o diferentes, en el que el resto haloalquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, clorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, trifluorometoxi y 2,2,2-trifluoroetoxi.
- 25 El grupo haloalcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo haloalcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto haloalcoxi y el resto alcoxi tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, clorometoximetilo, difluorometoximetilo, clorodifluorometoximetilo, trifluorometoximetilo y 2,2,2-trifluoroetoximetilo.
- 30 El grupo haloalcoxi C_1 - C_6 -alcoxi C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo haloalcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto haloalcoxi y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, clorometoximetoxi, difluorometoximetoxi, clorodifluorometoximetoxi, trifluorometoximetoxi y 2,2,2-trifluoroetoximetoxi.
- 35 El grupo alquiltio C_1 - C_6 -alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con un grupo alquiltio que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquiltio y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-metiltioetoximetilo y 2-etiltioetoximetilo.
- 40 El grupo alquilsulfinil C_1 - C_6 -alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con un grupo alquilsulfinilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilsulfinilo, el resto alcoxi y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-metilsulfiniletoximetilo y 2-etilfulfonilmetoximetilo.
- 45 El grupo alquilsulfonil C_1 - C_6 -alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con un grupo ciano, en el que el resto alcoxi y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-cianoetoximetilo y 3-cianopropoximetilo.
- 50 El grupo cianoalquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo ciano, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, cianometilo y 2-cianoetilo.
- 55 El grupo alquilcarbonilo C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (alquil)-C(=O)-O que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilo tienen el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, acetoximetilo, propioniloximetilo, isopropioniloximetilo y pivaloiloximetilo.

El grupo acil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo acilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto acilo y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-oxopropilo, 3-oxopropilo y 3-oxobutilo.

- 5 El grupo di(alcoxi C₁-C₆)alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono disustituido con grupos alcoxi que tienen cada uno de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alcoxi y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, (2,2-dimetoxi)etilo, (3,3-dimetoxi)propilo, (2,2-dietoxi)etilo y (3,3-dietoxi)propilo.
- 10 El grupo alcoxicarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxicarbonilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alcoxi y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-metoxi-2-oxoetilo, 2-etoxi-2-oxoetilo y 2-terc-butoxi-2-oxoetilo.
- 15 El grupo alcoxiimino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (alcoxi)-N= que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alcoxi y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-metoxiiminoetilo y 3-metoxiiminopropilo.

El grupo arilo C₅-C₁₀ se puede ejemplificar por medio de grupos tales como fenilo y naftilo.

- 20 El grupo aril C₆-C₁₀-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo arilo que tiene de 6 a 10 átomos de carbono, en el que el resto arilo y el resto alquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, bencilo, fenetilo, 3-fenilpropilo, nafatalen-1-ilmetilo y naftalen-2-ilmetilo.
- 25 El grupo halocicloalquilo C₃-C₈ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono sustituido con 1 a 5, preferentemente de 1 a 3, átomos de halógeno, en el que el resto cicloalquilo y el átomo de halógeno tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2,2-difluorociclopropilo y 2,2-diclorociclopropilo.

- 30 El grupo nitroalquilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo nitro, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-nitroetilo.

- 35 El grupo hidroxialquilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo hidroxilo en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-hidroxietilo y 3-hidroxietilo.

El grupo acilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo amino sustituido con un grupo acilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto acilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, formamida, acetamida y propionamida.

- 40 El grupo (R⁶R⁷N-C=O)alquilo C₁-C₆ represente, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con (R⁶R⁷N-C=O), en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilaminocarbonilmetilo, N,N-dimetilaminocarboniletilo y N-metil-N-etilaminocarbonilmetilo.

- 45 Se puede ejemplificar la cadena de alquileo C₂-C₅, a menos que se encuentre particularmente limitado, por medio de grupos tales como etileno, trimetileno, propileno, tetrametileno y pentametileno.

- 50 El grupo heterocíclico oxialquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (eterocíclico)-O, en el que el resto alquilo y el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno tienen el mismo significado que se ha comentado anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-(2-piridiloxi)etilo, 2-(2-piraziniloxi)etilo y 2-(2-tiazolil)etilo.

- 55 El grupo cicloalquilo C₃-C₈ alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆ representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono, en el que el resto

alquilo, el resto alcoxi y el resto cicloalquilo tienen respectivamente el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, ciclopropilmetiloximetilo, ciclobutilmetiloximetilo, ciclopentilmetiloximetilo y ciclohexilmetiloximetilo.

- 5 El grupo fenilsulfinilalquilo C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (fenil)-SO-, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, fenilsulfinilmetilo, 2-fenilsulfinilmetilo y 3-fenilsulfinilpropilo.

- 10 El grupo fenilsulfonilalquilo C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (fenil)-SO₂-, en el que el resto alquilo tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2-fenilsulfonilmetilo, 3-fenilsulfonilpropilo y 4-fenilsulfonilbutilo.

El grupo alquilideno C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo divalente de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metileno, etilideno, propilideno e isopropilideno.

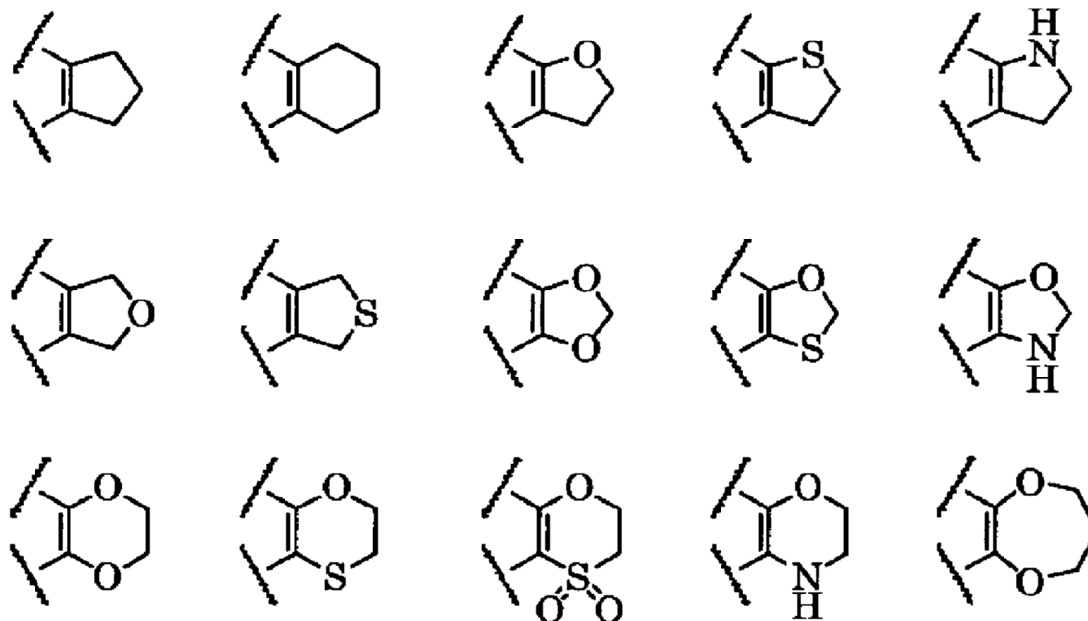
- 15 El grupo alquiliden C_1-C_6 -aminoxialquilo C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo (alquiliden)=N-O que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en el que el resto alquilideno y el resto alquilo tienen el mismo significado que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, metilenaaminoximetilo, 2-(etilidenaaminoxi)metilo y 2-(isopropilidenaaminoxi)etilo.

- 20 El grupo halocicloalquilo C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 representa, a menos que se encuentre particularmente limitado, un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 5, preferentemente de 1 a 3 átomos de halógeno, en el que el resto cicloalquilo, el resto alquilo y el átomo de halógeno tienen el mismo significado respectivamente que se ha definido anteriormente, y se pueden incluir grupos tales como, por ejemplo, 2,2-difluorociclopropilmetilo y 2,2-diclorociclopropilmetilo.

El metal alcalino se puede ejemplificar por medio de sodio, potasio y similar.

- 30 Las frases "los dos R^2 adyacentes se pueden unir junto con los respectivos átomos de carbono a los que se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros, o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno", "los dos R^{12} adyacentes se pueden unir junto con los respectivos átomos de carbono a los que se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros, o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno" y "los dos R^{13} adyacentes se pueden unir junto con los respectivos átomos de carbono a los que se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros, o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno" pueden ser ejemplificadas por medio de la siguiente, a menos que se encuentren particularmente limitados.

[Fórmula Química 5]



X^1 en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un átomo de oxígeno o un átomo de azufre. Un X^1 preferido incluye un átomo de oxígeno. Con respecto a la fórmula [I], X^1 se describe en forma de un grupo carbonilo; no obstante, es en caso en el que el sustituyente R^1 del átomo de nitrógeno adyacente sea tal como un átomo de hidrógeno, X^1 no se encuentra en forma de carbonilo, sino que puede existir en forma de enol, que es un tautómero de la forma de carbonilo.

X^2 en la fórmula [I] de la presente invención representa $=CH-$ o $=N(O)_m$ (con la condición de que m represente un número entero de 0 a 1). Cuando X^2 es $=CH-$, el anillo de 6 miembros que contiene X^2 se convierte en un anillo de benceno que se condensa con un anillo de pirazina, para de este modo formar un anillo benzopirazina. El anillo benceno formado de este modo puede estar sustituido con un sustituyente R^2 en la posición de X^2 , como es el caso de los otros átomos de carbono del anillo de benceno. En la presente memoria descriptiva, esto se expresa de manera que "el átomo de carbono puede estar sustituido con R^2 ". Además, cuando X^2 representan $=N(O)_m$, es decir, $=N-$ o $=N(O)-$, el anillo de 6 miembros que contiene X^2 se convierte en un anillo piridina o un anillo de N-óxido que se condensa con un anillo pirazina, formando de este modo un anillo piridopirazina o un anillo N-óxido. X^2 preferido en la fórmula [I] de la presente invención incluye $=CH-$, $=C(R^2)-$ o $=N-$.

R^1 en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C_1-C_{12} ; un grupo alqueno C_2-C_6 ; un grupo alquino C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalqueno C_2-C_6 ; un grupo haloalquino C_2-C_6 ; un grupo aminoalquilo C_1-C_6 ; un grupo nitroalquilo C_1-C_6 ; un grupo mono(alquil C_1-C_6)amino alquilo C_1-C_6 ; un grupo di(alquil C_1-C_6)aminoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfinil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfinil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ; un grupo fenilalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o más de R^4 idénticos o diferentes); un grupo alcoxi C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo feniloxialquilo C_1-C_6 (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o más de R^4 idénticos o diferentes); un grupo feniltioalquilo C_1-C_6 (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^4 idénticos o diferentes); un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^5 idénticos o diferentes); un grupo alquiltio C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_5 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarbonilo C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo di(alcoxi C_1-C_6)-alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcocarbonil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxiiimino C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo $(R^6R^7N=C=O)$ alquilo C_1-C_6 ; un grupo aril C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^8 idénticos que se describen a continuación; un grupo alquilo C_1-C_6 heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos

de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno en el grupo, pueden estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes); un grupo $NR^{10}R^{11}$; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo arilo C_6-C_{10} (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes que se describen a continuación); o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} que son idénticos o diferentes que se describen a continuación).

Ejemplos preferidos de R^1 incluyen un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C_1-C_{12} ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo feniloxialquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo tetrahidrofuranalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxycarbonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo $(R^6R^7N-C=O)$ alquilo C_1-C_6 ; un grupo aril C_6-C_{10} alquilo C_1-C_6 (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^8 idénticos que se describen a continuación); un grupo alquilo C_1-C_6 heterocíclico (el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes que se describen a continuación); un grupo $NR^{10}R^{11}$; un grupo arilo C_6-C_{10} (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes que se describen a continuación); un grupo heterocíclico (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} que son idénticos o diferentes que se describen a continuación), y similares. Ejemplos más preferidos de R^1 incluyen un grupo alquilo C_1-C_{12} ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo tetrahidrofuranalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo aril C_6-C_{10} alquilo C_1-C_6 (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^8 idénticos que se describen a continuación); un grupo alquilo C_1-C_6 heterocíclico (el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes que se describen a continuación); un grupo arilo C_6-C_{10} (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes que se describen a continuación); un grupo heterocíclico (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} que son idénticos o diferentes que se describen a continuación) y similares.

R^2 en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo halocicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cicloalcoxi C_3-C_8 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo amino; un grupo mono(alquil C_1-C_6) amino; un grupo di(alquil C_1-C_6) amino; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxiamino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; un grupo mono(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno; y similares.

Ejemplos preferidos de R^2 incluyen un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 ; y similares.

Ejemplos más preferidos de R^2 incluyen un átomo de halógeno; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 ; y similares, e incluso más preferentemente un átomo de halógeno; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; y un grupo alcoxi C_1-C_6 .

En la fórmula [I] de la presente invención, n es un número entero de 0 a 4 (con la condición de que cuando X^2 es $N(O)_m$, un número de entero de 0 a 3), preferentemente de 0 a 2, y más preferentemente de 0 a 1.

R^3 en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un grupo hidroxilo; $O-M^+$ (en el que M^+ es un catión de metal alcalino o un catión de amonio); un grupo amino; un átomo de halógeno; un grupo alquilsulfoniloxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 ; un grupo alqueniltio C_2-C_6 ; un grupo alquenilsulfonil C_2-C_6 ; un grupo alquenilsulfonil C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_2-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_2-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 ; un grupo alquenilcarboniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_2-C_6 ; un grupo fenoxi (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes); un grupo feniltio (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes); un grupo fenilsulfonil (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes); un grupo fenilsulfoniloxi (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes); un grupo

fenilcarboniloxi (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes); un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo; un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo; un grupo 1,2,3-triazol-2-ilo; un grupo imidazol-1-ilo; un grupo pirazol-1-ilo; un grupo tetrazol-1-ilo; o un grupo tetrazol-2-ilo; y similares. Un ejemplo preferido de R^3 incluye un grupo hidroxilo y también se pueden emplear sus derivados y sus sales, éteres y ésteres de estos grupos.

5 Un ejemplo más preferido de R^3 incluye un grupo hidroxilo.

R^8 en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfinilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfinilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; o un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 . Ejemplos preferidos de R^8 incluyen un átomo de halógeno; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; y similares.

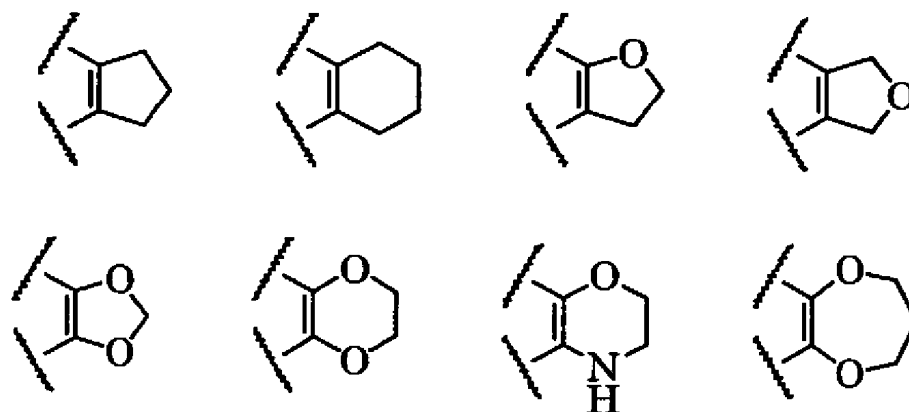
R^9 en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfinilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfinilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 .

20 Ejemplos preferidos de R^9 incluyen un grupo alquilo C_1-C_6 ; un átomo de halógeno; un grupo haloalquilo C_1-C_6 y similares.

R^{12} en la fórmula [I] de la presente invención se puede ejemplificar por medio de un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cicloalquiloxi C_3-C_8 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfinilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfinilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo amino; un grupo acilamino C_1-C_6 ; un grupo mono(alquil C_1-C_6)amino; un grupo di(alquil C_1-C_6)amino; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquiloxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxiiimino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo carboxilo; un grupo alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; un grupo carbamoilo; un grupo mono (alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes que se describen a continuación); un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes que se describen a continuación); y similares.

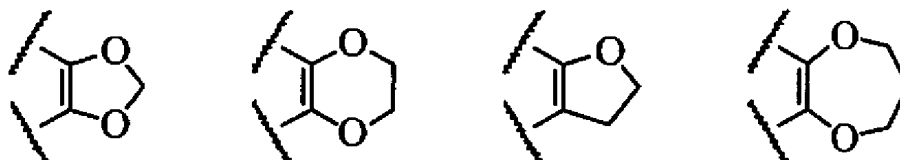
40 Ejemplos preferidos de R^{12} incluyen un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquiloxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; un grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo; un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 y los que se muestran a continuación.

[Fórmula Química 6]



Ejemplos más preferidos de R^{12} incluyen un átomo de halógeno; grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquenoiloxi C_2-C_6 ; un grupo alquinoxiloxi C_2-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; y los que se muestran a continuación.

[Fórmula Química 7]



5

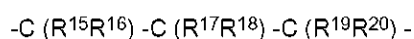
Sus ejemplos más preferidos incluyen un átomo de halógeno; grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; y los que se muestran a continuación.

[Fórmula Química 8]

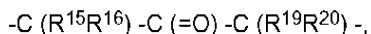


10

A^1 en la fórmula [I] de la presente invención representa $-C(R^{15}R^{16})-$.
 A^2 en la fórmula [I] de la presente invención representa $-C(R^{17}R^{18})-$ o $C=O$.
 A^3 en la fórmula [I] de la presente invención representa $-C(R^{19}R^{20})-$.
 Es decir, $-A^1-A^2-A^3$ en la fórmula [I] de la presente invención representa:



0



y forman un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono adyacentes.

R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} y R^{20} usados en el presente documento incluyen cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno; o un grupo alquilo C_1-C_6 . Además, R^{15} y R^{20} pueden unirse con los átomos de carbono adyacentes para formar un anillo carbocíclico de 5 a 10 miembros y preferentemente de 5 a 8 miembros. En otras palabras, R^{15} y R^{20} pueden unirse para formar una cadena de alquileo C_2-C_5 divalente lineal o ramificada. Un grupo alquileo preferido se puede ejemplificar por medio de un grupo etileno.

Ejemplos específicos del grupo heterocíclico como se indica en el "grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos de forma arbitraria escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno", "grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno", "grupo alquilo C_1-C_6 heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno" o "un grupo alcoxi C_1-C_6 heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno" incluyen tetrahidrofurano, tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol y similares.

Un grupo de ejemplos preferidos de anillo heterocíclico incluye 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, piridina, pirazina, 1,3-benzodioxol y benzo-1,4-dioxano. Ejemplos más preferidos del anillo heterocíclico incluyen tiofeno, isoxazol, piridina, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano y similares.

El grupo heterocíclico formado a partir del anillo heterocíclico mostrado en la fórmula [I] de la presente invención se puede preparar para dar lugar a un radical que está unido en cualquier posición de un anillo heterocíclico seleccionado. Incluso en el caso en el que el anillo heterocíclico escogido sea un anillo condensado con un anillo de benceno, la posición en la cual se forma el radical no se encuentra limitada al resto heterocíclico, y también se puede escoger la posición sobre el anillo de benceno.

Ejemplos preferidos específicos del compuesto representado por medio de la fórmula [I] de la presente invención se muestran en la siguiente Tabla 1 a Tabla 45. No obstante, no se pretende que el compuesto de la presente invención se encuentre limitado a estos compuestos. De manera adicional, se hace referencia a los números de los compuestos en las siguientes memorias descriptivas.

Las siguientes anotaciones en las tablas de la presente memoria descriptiva representan los grupos correspondientes como se indica a continuación. Por ejemplo,

Me representa un grupo metilo,

Et representa un grupo etilo,

n-Pr representa un grupo n-propilo,

i-Pr representa un grupo isopropilo,

c-Pr representa un grupo ciclopropilo,

n-Bu representa un grupo n-butilo,

s-Bu representa un grupo sec-butilo,

i-Bu representa un grupo isobutilo,

t-Bu representa un grupo terc-butilo,

c-Bu representa un grupo ciclobutilo,

n-Pen representa un grupo n-pentilo,

c-Pen representa un grupo ciclopentilo,

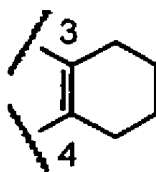
n-Hex representa un grupo n-hexilo,

Ph representa un grupo fenilo,

Bn representa un grupo bencilo,

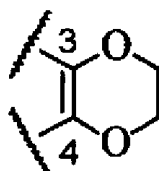
"-" para R^2 y R^{12} implica que son no sustituidos, (4-Cl)Bn representa un grupo 4-clorobencilo, 3,4-($CH_2CH_2CH_2CH_2$)- representa la siguiente estructura química en la que la posición 3 y la posición 4 se encuentran unidas por medio del grupo butileno para formar un anillo;

[Fórmula Química 9]



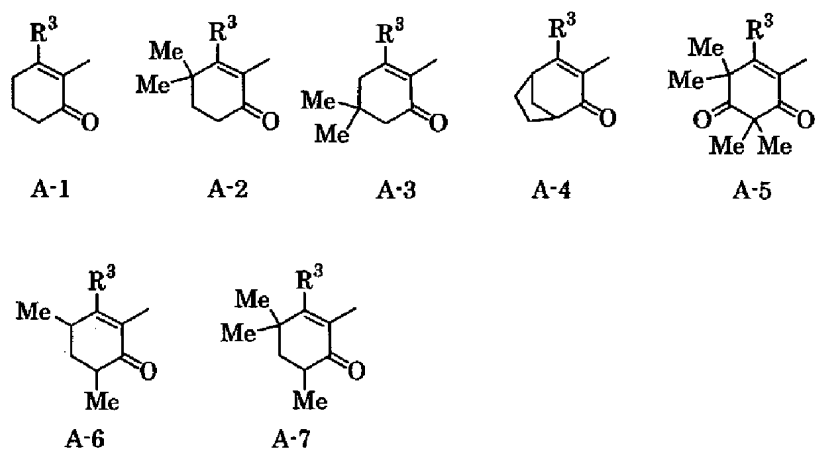
y 3,4-(OCH₂CH₂O)-representa la siguiente estructura química en la que la posición 3 y la posición 4 se encuentran unidas de forma similar por medio del grupo etilendioxi para formar un anillo:

[Fórmula Química 10]

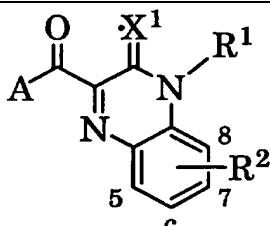


- 5 Además, con respecto a A en las tablas, A-1, A-2, A-3, A-4, A-5, A-6 y A-7 respectivamente representan los siguientes grupos

[Fórmula Química 11]



[Tabla 1]

					
Compuesto N°	A	X¹	R¹	R²	R³
I-1	A-1	O	H	-	OH
I-2	A-1	O	Me	-	OH
I-3	A-2	O	Me	-	OH
I-4	A-3	O	Me	-	OH
I-5	A-4	O	Me	-	OH
I-6	A-5	O	Me	-	OH
I-7	A-1	O	Et	-	OH
I-8	A-2	O	Et	-	OH
I-9	A-3	O	Et	-	OH
I-10	A-4	O	Et	-	OH
I-11	A-5	O	Et	-	OH
I-12	A-1	O	n-Pr	-	OH
I-13	A-1	O	i-Pr	-	OH
I-14	A-1	O	c-Pr	-	OH
I-15	A-1	O	n-Bu	-	OH
I-16	A-1	O	s-Bu	-	OH
I-17	A-1	O	i-Bu	-	OH
I-18	A-1	O	t-Bu	-	OH
I-19	A-1	O	c-Bu	-	OH
I-20	A-1	O	n-Pen	-	OH
I-21	A-1	O	c-Pen	-	OH
I-22	A-1	O	n-Hex	-	OH
I-23	A-1	O	c-Hex	-	OH
I-24	A-1	O	n-C ₇ H ₁₅	-	OH
I-25	A-1	O	n-C ₈ H ₁₇	-	OH
I-26	A-1	O	n-C ₉ H ₁₉	-	OH
I-27	A-1	O	n-C ₁₀ H ₂₁	-	OH
I-28	A-1	O	n-C ₁₁ H ₂₃	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-29	A-1	O	n-C ₁₂ H ₂₅	-	OH
I-30	A-1	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
I-31	A-2	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
I-32	A-3	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
I-33	A-4	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH

[Tabla 2]

Compuesto N°	A	x1	R ¹	R ²	R ³
I-34	A-5	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
I-35	A-1	O	CH ₂ C≡CH	-	OH
I-36	A-2	O	CH ₂ C≡CH	-	OH
I-37	A-3	O	CH ₂ C≡CH	-	OH
I-38	A-4	O	CH ₂ C≡CH	-	OH
I-39	A-5	O	CH ₂ C≡CH	-	OH
I-40	A-1	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
I-41	A-2	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
I-42	A-3	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
I-43	A-4	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
I-44	A-5	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
I-45	A-1	O	CH ₂ CH ₂ ^F	-	OH
I-46	A-1	O	CH ₂ CH ₂ Cl	-	OH
I-47	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	-	OH
I-48	A-1	O	CH ₂ CH=CCl ₂	-	OH
I-49	A-1	O	CH ₂ OMe	-	OH
I-50	A-1	O	CH ₂ OEt	-	OH
I-51	A-2	O	CH ₂ OEt	-	OH
I-52	A-3	O	CH ₂ OEt	-	OH
I-53	A-4	O	CH ₂ OEt	-	OH
I-54	A-5	O	CH ₂ OEt	-	OH
I-56	A-1	O	CH(Me)OMe	-	OH
I-56	A-1	O	CH(Me)OEt	-	OH
I-57	A-1	O	CH ₂ OPh	-	OH
I-58	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH

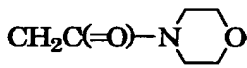
(Continuación)

Compuesto N°	A	x1	R ¹	R ²	R ³
I-59	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
I-60	A-2	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
I-61	A-3	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
I-62	A-4	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
I-63	A-5	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
I-64	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	-	OH
I-65	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ 	-	OH
I-66	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ 	-	OH
I-67	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
I-68	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	-	OH
I-69	A-1	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	-	OH
I-70	A-1	O	CH ₂ SMe	-	OH

[Tabla 3]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-71	A-4	O	CH ₂ SMe	-	OH
I-72	A-1	O	CH ₂ SEt	-	OH
I-73	A-1	O	CH ₂ S-n-Pr	-	OH
I-74	A-1	O	CH(Me)SMe	-	OH
I-75	A-1	O	CH(Me)SEt	-	OH
I-76	A-1	O	CH(Me)S-n-Pr	-	OH
I-77	A-1	O	CH ₂ SOMe	-	OH
I-78	A-1	O	CH ₂ SOEt	-	OH
I-79	A-1	O	CH ₂ SO-n-Pr	-	OH
I-80	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
I-81	A-4	O	CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
I-82	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Et	-	OH
I-83	A-1	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	-	OH
I-84	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Me	-	OH
I-85	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Et	-	OH

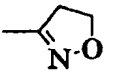
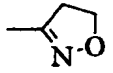
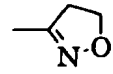
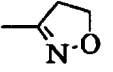
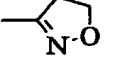
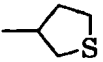
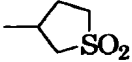
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-86	A-1	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	-	OH
I-87	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OH	-	OH
I-88	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
I-89	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OEt	-	OH
I-90	A-1	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-	OH
I-91	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SMe	-	OH
I-92	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
I-93	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
I-94	A-1	O	CH ₂ C(=O)Me	-	OH
I-95	A-1	O	CH ₂ C(=O)OMe	-	OH
I-96	A-1	O	CH ₂ C(=O)OEt	-	OH
I-97	A-1	O	CH ₂ C(=O)O-n-Pr	-	OH
I-98	A-1	O	CH ₂ C(=O)O-i-Pr	-	OH
I-99	A-1	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	-	OH
I-100	A-1	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	-	OH
I-101	A-1	O		-	OH
I-102	A-1	O	CH ₂ CN	-	OH
I-103	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CN	-	OH
I-104	A-1	O	CH(Me)CH ₂ CN	-	OH
I-105	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	-	OH
I-106	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	-	OH
I-107	A-1	O	Bn	-	OH
I-108	A-1	O	(2-F)Bn	-	OH

[Tabla 4]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-109	A-1	O	(3-F)Bn	-	OH
I-110	A-1	O	(4-F)Bn	-	OH
I-111	A-1	O	(2-Cl)Bn	-	OH
I-112	A-1	O	(3-Cl)Bn	-	OH
I-113	A-1	O	(4-Cl)Bn	-	OH
I-114	A-1	O	(2-Me)Bn	-	OH

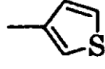
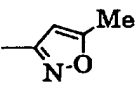
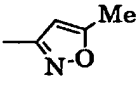
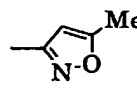
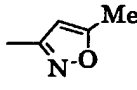
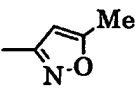
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-115	A-1	O	(3-Me)Bn	-	OH
I-116	A-1	O	(4-Me)Bn	-	OH
I-117	A-1	O	(2-CF ₃)Bn	-	OH
I-118	A-1	O	(3-CF ₃)Bn	-	OH
I-119	A-1	O	(4-CF ₃)Bn	-	OH
I-120	A-1	O	(2-OMe)Bn	-	OH
I-121	A-2	O	(2-OMe)Bn	-	OH
I-122	A-3	O	(2-OMe)Bn	-	OH
I-123	A-4	O	(2-OMe)Bn	-	OH
I-124	A-5	O	(2-OMe)Bn	-	OH
I-125	A-1	O	(3-OMe)Bn	-	OH
I-126	A-1	O	(4-OMe)Bn	-	OH
I-127	A-1	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	-	OH
I-128	A-1	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	-	OH
I-129	A-1	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	-	OH
I-130	A-1	O	CH(Me)Ph	-	OH
I-131	A-1	O		-	OH
I-132	A-2	O		-	OH
I-133	A-3	O		-	OH
I-134	A-4	O		-	OH
I-135	A-5	O		-	OH
I-136	A-1	O		-	OH
I-137	A-1	O		-	OH

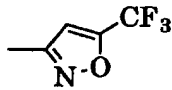
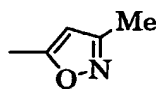
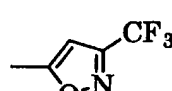
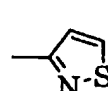
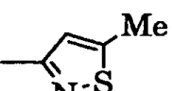
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-138	A-1	O		-	OH

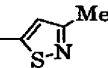
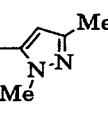
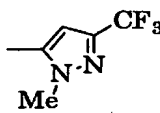
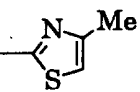
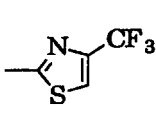
[Tabla 5]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-139	A-1	O		-	OH
I-140	A-2	O		-	OH
I-141	A-3	O		-	OH
I-142	A-4	O		-	OH
I-143	A-5	O		-	OH
I-144	A-1	O		-	OH
I-145	A-1	O		-	OH
I-146	A-2	O		-	OH
I-147	A-3	O		-	OH
I-148	A-4	O		-	OH
I-149	A-5	O		-	OH

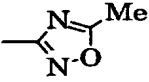
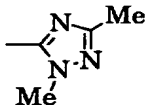
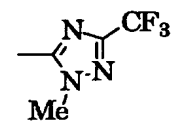
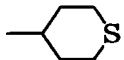
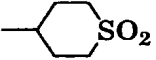
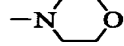
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-150	A-1	O		-	OH
I-151	A-1	O		-	OH
I-152	A-1	O		-	OH
I-153	A-1	O		-	OH
I-154	A-1	O		-	OH

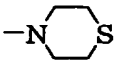
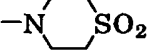
[Tabla 6]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-155	A-1	O		-	OH
I-156	A-1	O		-	OH
I-157	A-1	O		-	OH
I-158	A-1	O		-	OH
I-159	A-1	O		-	OH
I-160	A-1	O		-	OH
I-161	A-1	O		-	OH

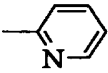
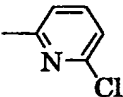
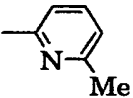
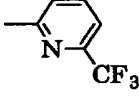
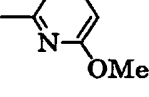
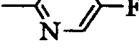
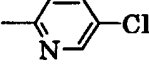
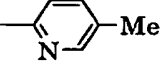
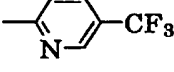
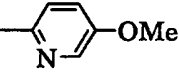
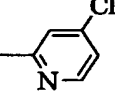
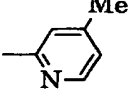
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-162	A-1	O		-	OH
I-163	A-1	O		-	OH
I-164	A-1	O		-	OH
I-165	A-1	O		-	OH
I-166	A-1	O		-	OH
I-167	A-1	O		-	OH
I-168	A-1	O		-	OH

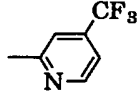
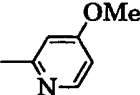
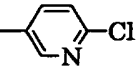
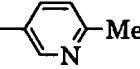
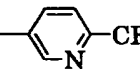
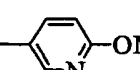
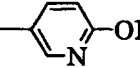
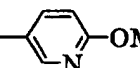
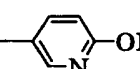
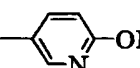
[Tabla 7]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-169	A-1	O		-	OH
I-170	A-1	O		-	OH

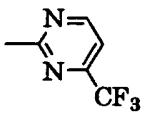
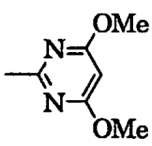
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-171	A-1	O		-	OH
I-172	A-1	O		-	OH
I-173	A-1	O		-	OH
I-174	A-1	O		-	OH
I-175	A-1	O		-	OH
I-176	A-1	O		-	OH
I-177	A-1	O		-	OH
I-178	A-1	O		-	OH
I-179	A-1	O		-	OH
I-180	A-1	O		-	OH
I-181	A-1	O		-	OH
I-182	A-1	O		-	OH

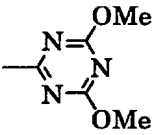
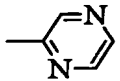
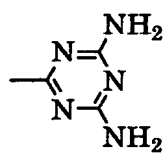
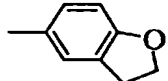
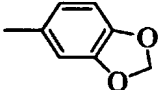
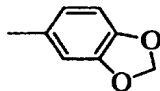
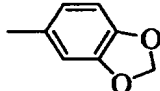
[Tabla 8]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-183	A-1	O		-	OH
I-184	A-1	O		-	OH
I-185	A-1	O		-	OH
I-186	A-1	O		-	OH
I-187	A-1	O		-	OH
I-188	A-1	O		-	OH
I-189	A-1	O		-	OH
I-190	A-2	O		-	OH
I-191	A-3	O		-	OH
I-192	A-4	O		-	OH
I-193	A-5	O		-	OH
I-194	A-1	O		-	OH
I-195	A-1	O		-	OH

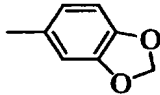
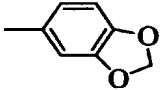
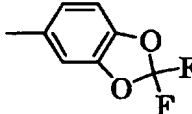
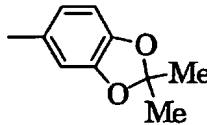
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-196	A-1	O		-	OH
I-197	A-1	O		-	OH

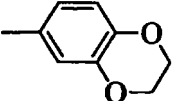
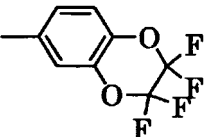
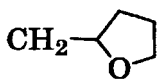
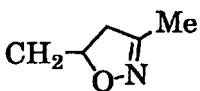
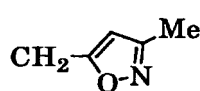
[Tabla 9]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-198	A-1	O		-	OH
I-199	A-1	O		-	OH
I-200	A-1	O		-	OH
I-201	A-1	O		-	OH
I-202	A-1	O		-	OH
I-203	A-2	O		-	OH
I-204	A-3	O		-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-205	A-4	O		-	OH
I-206	A-5	O		-	OH
I-207	A-1	O		-	OH
I-208	A-1	O		-	OH

[Tabla 10]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-209	A-1	O		-	OH
I-210	A-1	O		-	OH
I-211	A-1	O		-	OH
I-212	A-1	O		-	OH
I-213	A-1	O		-	OH
I-214	A-1	O	NH2	-	OH

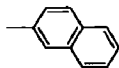
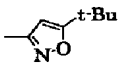
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-215	A-1	O	NHMe	-	OH
I-216	A-1	O	NMe ₂	-	OH
I-217	A-1	O	OMe	-	OH
I-218	A-1	O	OEt	-	OH
I-219	A-1	O	Me	5-F	OH
I-220	A-1	O	Me	6-F	OH
I-221	A-1	O	Me	7-F	OH
I-222	A-1	O	Me	8-F	OH
I-223	A-1	O	Me	5-Cl	OR
I-224	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	5-Cl	OH
I-225	A-1	O	Me	6-Cl	OH
I-226	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	6-Cl	OH
I-227	A-1	O	Me	7-Cl	OH
I-228	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	7-Cl	OH
I-229	A-1	O	Me	8-Cl	OH
I-230	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl	OH
I-232	A-1	O	Me	7-Me	OH
I-233	A-1	O	Me	6-CF ₃	OH
I-234	A-1	O	Me	7-CF ₃	OH
I-235	A-1	O	Me	6-OH	OH
I-236	A-1	O	Me	7-OH	OH

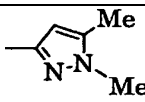
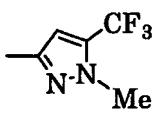
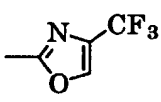
[Tabla 11]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-237	A-1	O	Me	6-OMe	OH
I-238	A-1	O	Me	7-OMe	OH
I-239	A-1	O	Me	6-OCF ₃	OH
I-240	A-1	O	Me	7-OCF ₃	OH
I-241	A-1	O	Me	5-SMe	OH
I-242	A-1	O	Me	6-SMe	OH
I-243	A-1	OO	Me	7-SMe	OH
I-244	A-1	O	Me	8-SMe	OH
I-245	A-1	O	Me	5-SO ₂ Me	OH

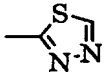
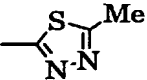
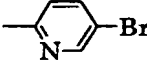
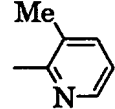
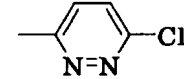
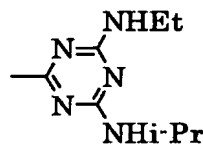
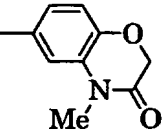
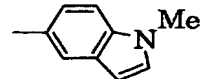
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-246	A-1	O	Me	6-SO ₂ Me	OH
I-247	A-1	O	Me	7-SO ₂ Me	OH
I-248	A-1	O	Me	8-SO ₂ Me	OH
I-249	A-1	O	Me	6-NO ₂	OH
I-250	A-1	O	Me	7-NO ₂	OH
I-251	A-1	O	Me	6-NH ₂	OH
I-252	A-1	O	Me	7-NH ₂	OH
I-253	A-1	O	Me	7-CN	OH
I-254	A-1	O	Me	6,7-Cl ₂	OH
I-255	A-1	O	Me	6,7-Me ₂	OH
I-256	A-1	S	Me	-	OH
I-257	A-4	O	Me	-	S(n-Hex)
I-258	A-4	O	Me	-	SO(n-Hex)
I-259	A-4	O	Me	-	SO ₂ (n-Hex)
I-260	A-4	O	Me	-	SPh
I-261	A-4	O	Me	-	SOPh
I-262	A-4	O	Me	-	SO ₂ Ph
I-263	A-1	O		-	OH
I-264	A-1	O		-	OH
I-265	A-1	O		-	OH

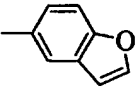
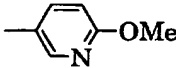
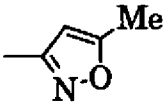
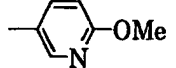
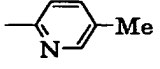
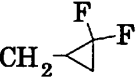
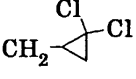
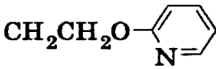
[Tabla 12]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-266	A-1	O		-	OH
I-267	A-1	O		-	OH
I-268	A-1	O		-	OH

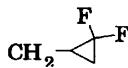
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-269	A-1	O		-	OH
I-270	A-1	O		-	OH
I-271	A-1	O		-	OH
I-272	A-1	O		-	OH
I-273	A-1	O		-	OH
I-274	A-1	O		-	OH
I-275	A-1	O		-	OH
I-276	A-1	O		-	OH

[Tabla 13]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-277	A-1	O		-	OH
I-278	A-1	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	-	OH
I-279	A-1	O		5-F	OH
I-280	A-1	O	Bn	6-F	OH
I-281	A-1	O		6-F	OH
I-282	A-1	O	Me	5-CH ₂ -OMe	OH
I-283	A-1	O		5,7-F ₂	OH
I-284	A-1	O		7-Cl	OH
I-285	A-1	O	CH ₂ -c-Pr	-	OH
I-286	A-1	O	CH ₂ -c-Bu	-	OH
I-287	A-1	O	CH ₂ c-Pen	-	OH
I-288	A-1	O	CH ₂ O-c-Pen	-	OH
I-289	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NH ₂	-	OH
I-290	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NHEt	-	OH
I-291	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	-	OH
I-292	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NEt ₂	-	OH
I-293	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CHO	-	OH
I-294	A-1	O		-	OH
I-295	A-1	O		-	OH
I-296	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ -C-Pr	-	OH
I-297	A-1	O	CH ₂ SPh	-	OH
I-298	A-1	O		-	OH

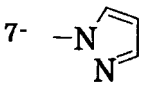
[Tabla 14]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-299	A-1	O	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	-	OH
I-300	A-1	O	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	-	OH
I-301	A-1	O	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-	OH
I-302	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph	-	OH
I-303	A-1	O	CH ₂ SOPh	-	OH
I-304	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Ph	-	OH
I-305	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SMe	-	OH
I-306	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SOMe	-	OH
I-307	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂	-	OH
I-308	A-1	O	CH ₂ C(Me)=NOMe	-	OH
I-309	A-1	O	CH ₂ CH ₂ ON=CM ₂	-	OH
I-310	A-1	O	Me	7-CH=CM ₂	OH
I-311	A-1	O	Me	7-C=CM ₂	OH
I-312	A-1	O	Me	7-CH ₂ -c-Pr	OH
I-313	A-1	O	Me	7-C(Me)=CF ₂	OH
I-314	A-1	O	Me	7- 	OH
I-315	A-1	O	Me	7-O-c-Pr	OH
I-316	A-1	O	Me	7- 	OH
I-317	A-1	O	Me	7-OCH ₂ -c-Pr	OH
I-318	A-1	O	Me	7-OCH ₂ OMe	OH
I-319	A-1	O	Me	7-OC(=O)Me	OH
I-320	A-1	O	Me	7-SOMe	OH
I-321	A-1	O	Me	7-SCF ₃	OH
I-322	A-1	O	Me	7-SOCH ₂ CF ₃	OH
I-323	A-1	O	Me	7-SO ₂ CH ₂ CF ₃	OH
I-324	A-1	O	Me	7-NMe ₂	OH
I-325	A-1	O	Me	7-NHC(=O)Me	OH
I-326	A-1	O	Me	7-CH ₂ OH	OH
I-327	A-1	O	Me	7-CH(OEt) ₂	OH
I-328	A-1	O	Me	7-CH ₂ SMe	OH
I-329	A-1	O	Me	7-CH ₂ SOMe	OH

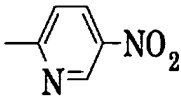
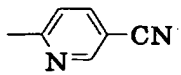
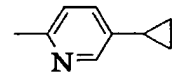
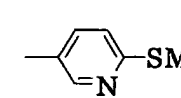
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-330	A-1	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ Me	OH
I-331	A-1	O	Me	7-CH ₂ SCHF ₂	OH
I-332	A-1	O	Me	7-CH ₂ SOCHF ₂	OH
I-333	A-1	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ CHF ₂	OH

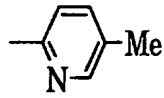
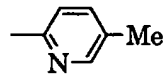
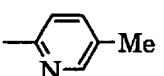
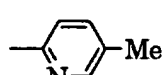
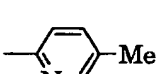
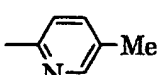
[Tabla 15]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-334	A-1	O	Me	7-CH ₂ CN	OH
I-335	A-1	O	Me	7-C(Me)=NOMe	OH
I-336	A-1	O	Me	7-C(=O)NH ₂	OH
I-337	A-1	O	Me	7- 	OH
I-338	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-F)	-	OH
I-339	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Cl)	-	OH
I-340	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-NO ₂)	-	OH
I-341	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CN)	-	OH
I-342	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Me)	-	OH
I-343	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CF ₃)	-	OH
I-344	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OMe)	-	OH
I-345	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OCF ₃)	-	OH
I-346	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SMe)	-	OH
I-347	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SO ₂ Me)	-	OH
I-348	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SCF ₃)	-	OH
I-349	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CO ₂ Me)	-	OH
I-350	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-COMe)	-	OH
I-351	A-1	O	(2-NO ₂)Bn	-	OH
I-352	A-1	O	(2-CN)Bn	-	OH
I-353	A-1	O	(3-SMe)Bn	-	OH
I-354	A-1	O	(3-SO ₂ Me)Bn	-	OH
I-355	A-1	O	(3-SCF ₃)Bn	-	OH
I-356	A-1	O	(3-CO ₂ Me)Bn	-	OH
I-357	A-1	O	(3-COMe)Bn	-	OH
I-358	A-1	O	(3-OMe)Bn	-	OH

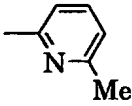
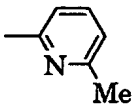
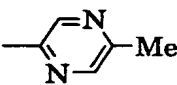
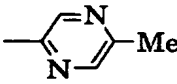
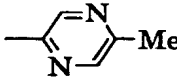
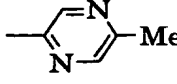
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-359	A-1	O		-	OH
I-360	A-1	O		-	OH
I-361	A-1	O		-	OH
I-362	A-1	O		-	OH

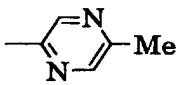
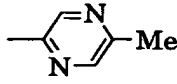
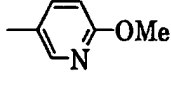
[Tabla 16]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-363	A-1	O	Et	5-Cl	OH
I-364	A-1	O	n-Bu	5-Cl	OH
I-365	A-1	O		5-F	OH
I-366	A-1	O		5-Cl	OH
I-367	A-1	O		5-Me	OH
I-368	A-1	O		7-Me	OH
I-369	A-1	O		7-CF ₃	OH
I-370	A-1	O		7-OMe	OH

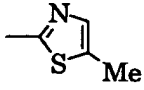
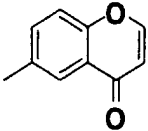
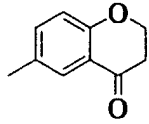
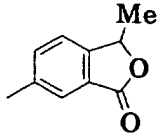
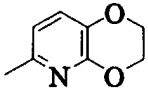
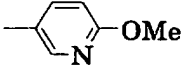
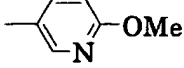
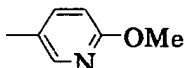
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-371	A-1	O		6-F	OH
I-372	A-1	O		6-CF ₃	OH
I-373	A-1	O		-	OH
I-374	A-1	O		5-F	OH
I-375	A-1	O		5-Cl	OH
I-376	A-1	O		5-Me	OH

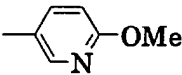
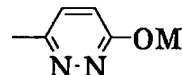
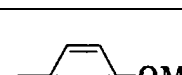
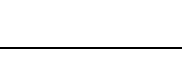
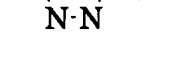
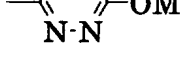
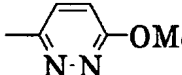
[Tabla 17]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-377	A-1	O		7-Me	OH
I-378	A-1	O		7-OMe	OH
I-379	A-1	O		5-Cl	OH

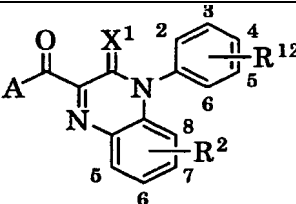
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-380	A-1	O		-	OH
I-381	A-1	O		-	OH
I-382	A-1	O		-	OH
I-383	A-1	O		-	OH
I-384	A-1	O		-	OH
I-385	A-1	O		5-Me	OH
I-386	A-1	O		5-Br	OH
I-387	A-1	O		7-Me	OH

[Tabla 18]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-388	A-1	O		7-OMe	OH
I-389	A-1	O		-	OH
I-390	A-1	O		5-F	OH
I-391	A-1	O		5-Cl	OH
I-392	A-1	O		5-Me	OH
I-393	A-1	O		7-Me	OH
I-394	A-1	O		7-OMe	OH
I-395	A-1	O		-	OH

[Tabla 19]

					
Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-1	A-1	O	-	-	OH
II-2	A-2	O	-	-	OH
II-3	A-3	O	-	-	OH
II-4	A-4	O	-	-	OH
II-5	A-5	O	-	-	OH
II-6	A-1	O	2-F	-	OH
II-7	A-1	O	3-F	-	OH
II-8	A-1	O	4-F	-	OH
II-9	A-1	O	2-Cl	-	OH
II-10	A-4	O	2-Cl	-	OH
II-11	A-1	O	3-Cl	-	OH
II-12	A-4	O	3-Cl	-	OH
II-13	A-1	O	4-Cl	-	OH
II-14	A-4	O	4-Cl	-	OH
II-15	A-5	O	4-Cl	-	OH
II-16	A-1	O	2-Br	-	OH
II-17	A-1	O	3-Br	-	OH
II-18	A-1	O	4-Br	-	OH
II-19	A-1	O	2-Me	-	OH
II-20	A-1	O	3-Me	-	OH
II-21	A-1	O	4-Me	-	OH
II-22	A-1	O	2-Et	-	OH
II-23	A-1	O	3-Et	-	OH
II-24	A-1	O	4-Et	-	OH
II-25	A-1	O	2-n-Pr	-	OH
II-26	A-1	O	3-n-Pr	-	OH
II-27	A-1	O	4-n-Pr	-	OH
II-28	A-1	O	2-i-Pr	-	OH
II-29	A-1	O	3-i-Pr	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-30	A-1	O	4-i-Pr	-	OH
II-31	A-1	O	2-c-Pr	-	OH
II-32	A-1	O	3-c-Pr	-	OH
II-33	A-1	O	4-c-Pr	-	OH

[Tabla 20]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-34	A-1	O	2-CF ₃	-	OH
II-35	A-2	O	2-CF ₃	-	OH
II-36	A-3	O	2-CF ₃	-	OH
II-37	A-4	O	2-CF ₃	-	OH
II-38	A-5	O	2-CF ₃	-	OH
II-39	A-1	O	3-CF ₃	-	OH
II-40	A-2	O	3-CF ₃	-	OH
II-41	A-3	O	3-CF ₃	-	OH
II-42	A-4	O	3-CF ₃	-	OH
II-43	A-5	O	3-CF ₃	-	OH
II-44	A-1	O	4-CF ₃	-	OH
II-45	A-2	O	4-CF ₃	-	OH
II-46	A-3	O	4-CF ₃	-	OH
II-47	A-4	O	4-CF ₃	-	OH
II-48	A-5	O	4-CF ₃	-	OH
II-49	A-1	O	2-OH	-	OH
II-50	A-1	O	3-OH	-	OH
II-51	A-1	O	4-OH	-	OH
II-52	A-1	O	2-OMe	-	OH
II-53	A-2	O	2-OMe	-	OH
II-54	A-3	O	2-OMe	-	OH
II-55	A-4	O	2-OMe	-	OH
II-56	A-5	O	2-OMe	-	OH
II-57	A-1	O	3-OMe	-	OH
II-58	A-2	O	3-OMe	-	OH
II-59	A-3	O	3-OMe	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-60	A-4	O	3-OMe	-	OH
II-61	A-5	O	3-OMe	-	OH
II-62	A-1	O	4-OMe	-	OH
II-63	A-2	O	4-OMe	-	OH
II-64	A-3	O	4-OMe	-	OH
II-65	A-4	O	4-OMe	-	OH
II-66	A-5	O	4-OMe	-	OH
II-67	A-1	O	2-OEt	-	OH
II-68	A-1	O	3-OEt	-	OH
II-69	A-1	O	4-OEt	-	OH
II-70	A-1	O	2-O-n-Pr	-	OH
II-71	A-1	O	3-O-n-Pr	-	OH
II-72	A-1	O	4-O-n-Pr	-	OH

[Tabla 21]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-73	A-1	O	2-O-i-Pr	-	OH
II-74	A-1	O	3-O-i-Pr	-	OH
II-75	A-1	O	4-O-i-Pr	-	OH
II-76	A-1	O	2-O-c-Pr	-	OH
II-77	A-1	O	3-O-c-Pr	-	OH
II-78	A-1	O	4-O-c-Pr	-	OH
II-79	A-1	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	-	OH
II-80	A-1	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	-	OH
II-81	A-1	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	-	OH
II-82	A-1	O	2-OCH ₂ C≡CH	-	OH
II-83	A-1	O	3-OCH ₂ C≡CH	-	OH
II-84	A-1	O	4-OCH ₂ C≡CH	-	OH
II-85	A-1	O	2-OCHF ₂	-	OH
II-86	A-2	O	2-OCHF ₂	-	OH
II-87	A-3	O	2-OCHF ₂	-	OH
II-88	A-4	O	2-OCHF ₂	-	OH
II-89	A-5	O	2-OCHF ₂	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-90	A-1	O	3-OCHF ₂	-	OH
II-91	A-2	O	3-OCHF ₂	-	OH
II-92	A-3	O	3-OCHF ₂	-	OH
II-93	A-4	O	3-OCHF ₂	-	OH
II-94	A-5	O	3-OCHF ₂	-	OH
II-95	A-1	O	4-OCHF ₂	-	OH
II-96	A-2	O	4-OCHF ₂	-	OH
II-97	A-3	O	4-OCHF ₂	-	OH
II-98	A-4	O	4-OCHF ₂	-	OH
II-99	A-5	O	4-OCHF ₂	-	OH
II-100	A-1	O	2-OCF ₃	-	OH
II-101	A-1	O	3-OCF ₃	-	OH
II-102	A-2	O	3-OCF ₃	-	OH
II-103	A-3	O	3-OCF ₃	-	OH
II-104	A-4	O	3-OCF ₃	-	OH
II-105	A-5	O	3-OCF ₃	-	OH
II-106	A-1	O	4-OCF ₃	-	OH
II-107	A-2	O	4-OCF ₃	-	OH
II-108	A-3	O	4-OCF ₃	-	OH
II-109	A-4	O	4-OCF ₃	-	OH
II-110	A-5	O	4-OCF ₃	-	OH
II-111	A-1	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH

[Tabla 22]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-112	A-1	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
II-113	A-1	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
II-114	A-1	O	2-OCH ₂ 	-	OH
II-115	A-1	O	3-OCH ₂ 	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-116	A-1	O	4-OCH₂ 	-	OH
II-117	A-1	O	2-OC(=O)Me	-	OH
II-118	A-1	O	3-OC(=O)Me	-	OH
II-119	A-1	O	3-OC(=O)Me	-	OH
II-120	A-1	O	2-SMe	-	OH
II-121	A-1	O	3-SMe	-	OH
II-122	A-1	O	4-SMe	-	OH
II-123	A-1	O	2-SO ₂ Me	-	OH
II-124	A-1	O	3-SO ₂ Me	-	OH
II-125	A-1	O	4-SO ₂ Me	-	OH
II-126	A-1	O	2-SCF ₃	-	OH
II-127	A-1	O	S-SCF ₃	-	OH
II-128	A-1	O	4-SCF ₃	-	OH
II-129	A-1	O	2-NO ₂	-	OH
II-130	A-1	O	3-NO ₂	-	OH
II-131	A-1	O	4-NO ₂	-	OH
II-132	A-1	O	2-NH ₂	-	OH
II-133	A-1	O	3-NH ₂	-	OH
II-134	A-1	O	4-NH ₂	-	OH
II-135	A-1	O	2-CN	-	OH
II-136	A-1	O	3-CN	-	OH
II-137	A-1	O	4-CN	-	OH
II-138	A-1	O	2-C(=O)Me	-	OH
II-139	A-1	O	3-C(=O)Me	-	OH
II-140	A-1	O	4-C(=O)Me	-	OH
II-141	A-1	O	2-C(=O)OH	-	OH
II-142	A-1	O	3-C(=O)OH	-	OH
II-143	A-1	O	4-C(=O)OH	-	OH
II-144	A-1	O	2-C(=O)OMe	-	OH
II-145	A-1	O	3-C(=O)OMe	-	OH
II-146	A-1	O	4-C(=O)OMe	-	OH

[Tabla 23]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-147	A-1	O	2-CH ₂ OMe	-	OH
II-148	A-1	O	3-CH ₂ OMe	-	OH
II-149	A-1	O	4-CH ₂ OMe	-	OH
II-150	A-1	O	2,3-F ₂	-	OH
II-151	A-1	O	2,4-F ₂	-	OH
II-152	A-1	O	2,5-F ₂	-	OH
II-153	A-1	O	2,6-F ₂	-	OH
II-154	A-1	O	3,4-F ₂	-	OH
II-155	A-1	O	3,5-F ₂	-	OH
II-156	A-1	O	2,3-Cl ₂	-	OH
II-157	A-1	O	2,4-Cl ₂	-	OH
II-158	A-1	O	2,5-Cl ₂	-	OH
II-159	A-1	O	2,6-Cl ₂	-	OH
II-160	A-1	O	3,4-Cl ₂	-	OH
II-161	A-1	O	3,5-Cl ₂	-	OH
II-162	A-1	O	2-F, 3-OMe	-	OH
II-163	A-1	O	2-Cl, 3-OMe	-	OH
II-164	A-1	O	2-Me, 3-OMe	-	OH
II-165	A-1	O	2,3-(OMe) ₂	-	OH
II-166	A-1	O	3-OMe, 4-F	-	OH
II-167	A-1	O	3-OMe, 4-Cl	-	OH
II-168	A-1	O	3-OMe, 4-Me	-	OH
II-169	A-1	O	3,4-(OMe) ₂	-	OH
II-170	A-1	O	3-OMe, 5-F	-	OH
II-171	A-1	O	3-OMe, 5-Cl	-	OH
II-172	A-1	O	3-OMe, 5-Me	-	OH
II-173	A-1	O	3,5-(OMe) ₂	-	OH
II-174	A-1	O	2-F, 4-OMe	-	OH
II-175	A-1	O	2-Cl, 4-OMe	-	OH
II-176	A-1	O	2-Me, 4-OMe	-	OH
II-177	A-1	O	2,4-(OMe) ₂	-	OH
II-178	A-1	O	3-F, 4-OMe	-	OH
II-179	A-1	O	3-Cl, 4-OMe	-	OH
II-180	A-1	O	3-Me, 4-OMe	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-181	A-1	O	2-F, 5-OMe	-	OH
II-182	A-1	O	2-Cl, 5-OMe	-	OH
II-183	A-1	O	2-Me, 5-OMe	-	OH
II-184	A-1	O	2,5-(OMe) ₂	-	OH
II-185	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	-	OH

[Tabla 24]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-186	A-1	O	4-OMe	5-F	OH
II-187	A-1	O	4-OMe	6-F	OH
II-188	A-1	O	4-OMe	7-F	OH
II-189	A-1	O	4-OMe	8-F	OH
II-190	A-1	O	-	5-Cl	OH
II-191	A-1	O	-	6-Cl	OH
II-192	A-1	O	-	7-Cl	OH
II-193	A-1	O	-	8-Cl	OH
II-194	A-1	O	4-OMe	5-Cl	OH
II-195	A-1	O	4-OMe	6-Cl	OH
II-196	A-1	O	4-OMe	7-Cl	OH
II-197	A-1	O	4-OMe	8-Cl	OH
II-198	A-1	S	-	-	OH
II-199	A-4	O	-	-	S(n-Hex)
II-200	A-4	O	-	-	SO(n-Hex)
II-201	A-4	O	-	-	SO ₂ (n-Hex)
II-202	A-4	O	-	-	SPh
II-203	A-4	O	-	-	SOPh
II-204	A-4	O	-	-	SO ₂ Ph
II-205	A-1	O	4-OCH ₂ CN	-	OH
II-206	A-1	O	3-OCH ₂ -c-Pr	-	OH
II-207	A-1	O	3-OCH ₂ CF ₃	-	OH
II-208	A-1	O	4-OCH ₂ -c-Pr	-	OH
II-209	A-1	O	4-OCH ₂ CF ₃	-	OH
II-210	A-1	O	4-NMe ₂	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-211	A-1	O	3,4-Me ₂	-	OH
II-212	A-1	O	2-F, 4-Me	-	OH
II-213	A-1	O	3-F, 4-Me	-	OH
II-214	A-1	O	3-Me, 4-F	-	OH
II-215	A-1	O	2-Cl, 4-Me	-	OH
II-216	A-1	O	3-Cl, 4-Me	-	OH
II-217	A-1	O	3-OEt, 4-OMe	-	OH
II-218	A-1	O	2,3,4-(OMe) ₃	-	OH
II-219	A-1	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	-	OH
II-220	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-	OH
II-221	A-1	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	-	OH
II-222	A-1	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-	OH
II-223	A-1	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-	OH

[Tabla 25]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-224	A-1	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	-	OH
II-225	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F	OH
II-226	A-1	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-	OH
II-227	A-2	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-	OH
II-228	A-3	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-	OH
II-229	A-6	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-	OH
II-230	A-7	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-	OH
II-231	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	-	OH
II-232	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	-	OH
II-233	A-1	O	-	5-F	OH
II-234	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F	OH
II-235	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F	OH
II-236	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F	OH
II-237	A-1	O	-	6-F	OH
II-238	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F	OH
II-239	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F	OH
II-240	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F	OH

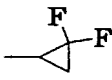
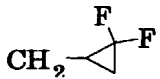
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-241	A-1	O	-	7-F	OH
II-242	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F	OH
II-243	A-1	O	-	8-F	OH
II-244	A-1	O	-	5-Me	OH
II-245	A-1	O	4-OMe	5-Me	OH
II-246	A-1	O	4-OMe	6-Me	OH
II-247	A-1	O	4-OMe	7-Me	OH
II-248	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me	OH
II-249	A-1	O	-	6-CF ₃	OH
II-250	A-1	O	-	6-OMe	OH
II-251	A-1	O	4-OMe	6-OMe	OH
II-252	A-1	O	-	7-OMe	OH
II-253	A-1	O	4-OMe	7-OMe	OH
II-254	A-1	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe	OH
II-255	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe	OH
II-256	A-1	O	-	8-OMe	OH
II-257	A-1	O	4-OMe	8-OMe	OH
II-258	A-1	O	4-OMe	5,6-F ₂	OH
II-259	A-1	O	4-OMe	5,7-F ₂	OH
II-260	A-1	O	-	6,7-F ₂	OH
II-261	A-1	O	-	6,8-F ₂	OH

[Tabla 26]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-262	A-1	O	4-OMe	5, 7-Cl ₂	OH
II-263	A-1	O	4-OMe	6-F, 7-OMe	OH
II-264	A-1	O	-	7-c-Pr	OH
II-265	A-1	O	-	7-OCH ₂ CH=CH ₂	OH
II-266	A-1	O	-	7-OCH ₂ C≡CH	OH
II-267	A-1	O	-	7-NHMe	OH
II-268	A-1	O	-	7-C(=O)H	OH
II-269	A-1	O	-	6-C(=O)Me	OH
II-270	A-1	O	-	7-C(=O)OH	OH

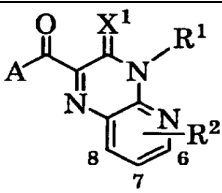
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-271	A-1	O	-	7-C(=O)OMe	OH
II-272	A-1	O	-	7-C(=O)OEt	OH
II-273	A-1	O	-	7-C(=O)NHNe	OH
II-274	A-1	O	-	7-C(=O)NMe ₂	OH
II-275	A-1	O	-	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)-	OH
II-276	A-1	O	-	6,7-(OCH ₂ O)-	OH
II-277	A-1	O	4-OMe	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)-	OH
II-278	A-1	O	4-OMe	6,7-(OCH ₂ O)-	OH
II-279	A-1	O	2-CONHMe	-	OH
II-280	A-1	O	2-CONMe ₂	-	OH
II-281	A-1	O	2-NHCOMe	-	OH
II-282	A-1	O	4-CH ₂ -c-Pr	-	OH
II-283	A-1	O	4-CH=CH ₂	-	OH
II-284	A-1	O	4-C≡CMe	-	OH
II-285	A-1	O	3-CH=CF ₂	-	OH
II-286	A-1	O	3- 	-	OH
II-287	A-1	O	4- 	-	OH
II-288	A-1	O	4-CH ₂ OH	-	OH
II-289	A-1	O	4-CH ₂ SMe	-	OH
II-290	A-1	O	4-CH ₂ SOMe	-	OH
II-291	A-1	O	4-CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
II-292	A-1	O	4-CH ₂ SCHF ₂	-	OH
II-293	A-1	O	4-CH ₂ SOCHF ₂	-	OH
II-294	A-1	O	4-CH ₂ SO ₂ CHF ₂	-	OH
II-295	A-1	O	4-CH ₂ CN	-	OH

[Tabla 27]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-296	A	O	4-NHMe	-	OH
II-297	A	O	4-OCH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
II-298	A	O	4-C(Me)=NOMe	-	OH
II-299	A	O	2-CONH ₂	-	OH
II-300	A	O	4- 	-	OH
II-301	A	O	3-F, 4-OMe	5-Cl	OH
II-302	A	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe	OH
II-303	A	O	--	7-CF ₃	OH
II-304	A	O	4-F	7-OMe	OH
II-305	A	O	4-OCHF ₂	7-OMe	OH
II-306	A	O	4-Me	7-OMe	OH
II-307	A	O	4-OMe	5-Br	OH
II-308	A	O	4-OMe	5-CN	OH
II-309	A	O	4-OMe	5-CF ₃	OH
II-310	A	O	2,3,5,6-F ₄ , 4-OMe	-	OH
II-311	A	O	4-Me	5-Cl	OH
II-312	A	O	3-F, 4-Me	5-Cl	OH
II-313	A	O	2-F, 4-OMe	5-Cl	OH
II-314	A	O	3-F	6-F	OH
II-315	A	O	3-Me	6-F	OH
II-316	A	O	3-F, 4-OMe	5-Me	OH
II-317	A	O	4-F	5-F	OH
II-318	A	O	4-F	5-Cl	OH
II-319	A-1	O	4-F	5-Me	OH
II-320	A-1	O	4-OCHF ₂	5-F	OH
II-321	A-1	O	4-OCHF ₂	5-Cl	OH
II-322	A-1	O	4-OCHF ₂	5-Me	OH
II-323	A-1	O	3-F, 4-OEt	-	OH

[Tabla 28]

					
Compuesto N°	A	X¹	R¹	R²	R³
III-1	A-1	O	H	-	OH
III-2	A-1	O	Me	-	OH
III-3	A-2	O	Me	-	OH
III-4	A-3	O	Me	-	OH
III-5	A-4	O	Me	-	OH
III-6	A-5	O	Me	-	OH
III-7	A-1	O	Et	-	OH
III-8	A-2	O	Et	-	OH
III-9	A-3	O	Et	-	OH
III-10	A-4	O	Et	-	OH
III-11	A-5	O	Et	-	OH
III-12	A-1	O	n-Pr	-	OH
III-13	A-1	O	i-Pr	-	OH
III-14	A-1	O	c-Pr	-	OH
III-15	A-1	O	n-Bu	-	OH
III-16	A-1	O	s-Bu	-	OH
III-17	A-1	O	i-Bu	-	OH
III-18	A-1	O	t-Bu	-	OH
III-19	A-1	O	c-Bu	-	OH
III-20	A-1	O	n-Pen	-	OH
III-21	A-1	O	c-Pen	-	OH
III-22	A-1	O	n-Hex	-	OH
III-23	A-1	O	c-Hex	-	OH
III-24	A-1	O	n-C ₇ H ₁₅	-	OH
III-25	A-1	O	n-C ₈ H ₁₇	-	OH
III-26	A-1	O	n-C ₉ H ₁₉	-	OH
III-27	A-1	O	n-C ₁₀ H ₂₁	-	OH
III-28	A-1	O	n-C ₁₁ H ₂₃	-	OH
III-29	A-1	O	n-C ₁₂ H ₂₅	-	OH
III-30	A-1	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH

Continuación

Compuesto N°	A	X1	R1	R2	R3
III-31	A-2	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
III-32	A-3	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
III-33	A-4	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
III-34	A-5	O	CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
III-35	A-1	O	CH ₂ C=CH	-	OH

[Tabla 29]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-36	A-2	O	CH ₂ C=CH	-	OH
III-37	A-3	O	CH ₂ C=CH	-	OH
III-38	A-4	O	CH ₂ C=CH	-	OH
III-39	A-5	O	CH ₂ C=CH	-	OH
III-40	A-1	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
III-41	A-2	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
III-42	A-3	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
III-43	A-4	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
III-44	A-5	O	CH ₂ CF ₃	-	OH
III-45	A-1	O	CH ₂ CH ₂ F	-	OH
III-46	A-1	O	CH ₂ CH ₂ Cl	-	OH
III-47	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	-	OH
III-48	A-1	O	CH ₂ CH=CCl ₂	-	OH
III-49	A-1	O	CH ₂ OMe	-	OH
III-50	A-1	O	CH ₂ OEt	-	OH
III-51	A-2	O	CH ₂ OEt	-	OH
III-52	A-3	O	CH ₂ OEt	-	OH
III-53	A-4	O	CH ₂ OEt	-	OH
III-54	A-5	O	CH ₂ OEt	-	OH
III-55	A-1	O	CH(Me)OMe	-	OH
III-56	A-1	O	CH(Me)OEt	-	OH
III-57	A-1	O	CH ₂ OPh	-	OH
III-58	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
III-59	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
III-60	A-2	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
III-61	A-3	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH

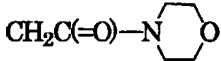
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-62	A-4	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
III-63	A-5	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-	OH
III-64	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	-	OH
III-65	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ 	-	OH
III-66	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ 	-	OH
III-67	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
III-68	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	-	OH
III-69	A-1	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	-	OH
III-70	A-1	O	CH ₂ SMe	-	OH
III-71	A-4	O	CH ₂ SMe	-	OH
III-72	A-1	O	CH ₂ SEt	-	OH

[Tabla 30]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-73	A-1	O	CH ₂ S-n-Pr	-	OH
III-74	A-1	O	CH(Me)SMe	-	OH
III-75	A-1	O	CH(Me)SEt	-	OH
III-76	A-1	O	CH(Me)S-n-Pr	-	OH
III-77	A-1	O	CH ₂ SOMe	-	OH
III-78	A-1	O	CH ₂ SOEt	-	OH
III-79	A-1	O	CH ₂ SO-n-Pr	-	OH
III-80	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
III-81	A-4	O	CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
III-82	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Et	-	OH
III-83	A-1	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	-	OH
III-84	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Me	-	OH
III-85	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Et	-	OH
III-86	A-1	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	-	OH
III-87	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OH	-	OH
III-88	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
III-89	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OEt	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-90	A-1	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-	OH
III-91	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SMe	-	OH
III-92	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-	OH
III-93	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
III-94	A-1	O	CH ₂ C(=O)Me	-	OH
III-95	A-1	O	CH ₂ C(=O)OMe	-	OH
III-96	A-1	O	CH ₂ C(=O)OEt	-	OH
III-97	A-1	O	CH ₂ C(=O)On-Pr	-	OH
III-98	A-1	O	CH ₂ C(=O)Oi-Pr	-	OH
III-99	A-1	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	-	OH
III-100	A-1	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	-	OH
III-101	A-1	O		-	OH
III-102	A-1	O	CH ₂ CN	-	OH
III-103	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CN	-	OH
III-104	A-1	O	CH(Me)CH ₂ CN	-	OH
III-106	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	-	OH
III-106	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	-	OH
III-107	A-1	O	Bn	-	OH
III-108	A-1	O	(2-F)Bn	-	OH
III-109	A-1	O	(3-F)Bn	-	OH
III-110	A-1	O	(4-F)Bn	-	OH
III-111	A-1	O	(2-Cl)Bn	-	OH

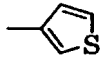
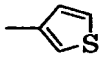
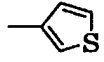
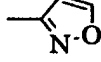
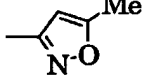
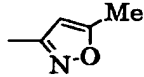
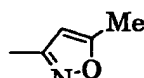
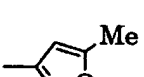
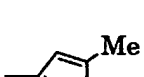
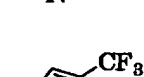
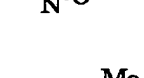
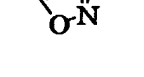
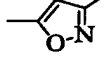
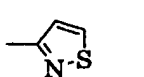
[Tabla 31]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-112	A-1	O	(3-Cl)Bn	-	OH
III-113	A-1	O	(4-Cl)Bn	-	OH
III-114	A-1	O	(2-Me)Bn	-	OH
III-115	A-1	O	(3-Me)Bn	-	OH
III-116	A-1	O	(4-Me)Bn	-	OH
III-117	A-1	O	(2-CF ₃)Bn	-	OH
III-118	A-1	O	(3-CF ₃)Bn	-	OH
III-119	A-1	O	(4-CF ₃)Bn	-	OH

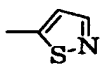
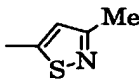
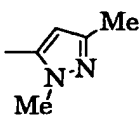
(Continuación)

Compuesto N°	A	X1	R ¹	R ²	R ³
III-120	A-1	O	(2-OMe)Bn	-	OH
III-121	A-2	O	(2-OMe)Bn	-	OH
III-122	A-3	O	(2-OMe)Bn	-	OH
III-123	A-4	O	(2-OMe)Bn	-	OH
III-124	A-5	O	(2-OMe)Bn	-	OH
III-125	A-1	O	(3-OMe)Bn	-	OH
III-126	A-1	O	(4-OMe)Bn	-	OH
III-127	A-1	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	-	OH
III-128	A-1	O	(2, 6-(OMe) ₂)Bn	-	OH
III-129	A-1	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	-	OH
III-130	A-1	O	CH(Me)Ph	-	OH
III-131	A-1	O		-	OH
III-132	A-2	O		-	OH
III-133	A-3	O		-	OH
III-134	A-4	O		-	OH
III-135	A-5	O		-	OH
III-136	A-1	O		-	OH
III-137	A-1	O		-	OH
III-138	A-1	O		-	OH
III-139	A-1	O		-	OH
III-140	A-2	O		-	OH

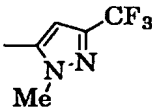
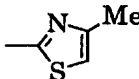
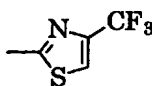
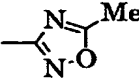
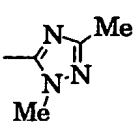
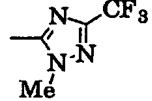
[Tabla 32]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-141	A-3	O		-	OH
III-142	A-4	O		-	OH
III-143	A-5	O		-	OH
III-144	A-1	O		-	OH
III 145	A-1	O		-	OH
III-146	A-2	O		-	OH
III-147	A-3	O		-	OH
III-148	A-4	O		-	OH
III-149	A-5	O		-	OR
III-150	A-1	O		-	OH
III-151	A-1	O		-	OH
III-152	A-1	O		-	OH
III-153	A-1	O		-	OH
III-154	A-1	O		-	OH

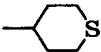
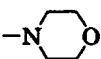
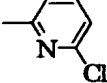
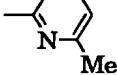
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-155	A-1	O		-	OH
III-156	A-1	O		-	OH
III-157	A-1	O		-	OH

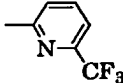
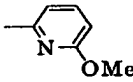
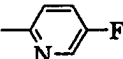
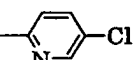
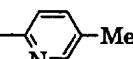
[Tabla 33]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-158	A-1	O		-	OH
III-159	A-1	O		-	OH
III-160	A-1	O		-	OH
III-161	A-1	O		-	OH
III-162	A-1	O		-	OH
III-163	A-1	O		-	OH
III-164	A-1	O		-	OH
III-165	A-1	O		-	OH

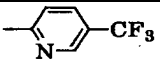
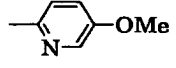
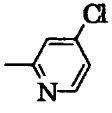
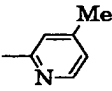
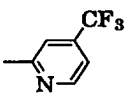
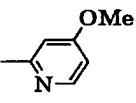
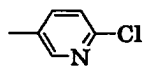
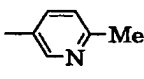
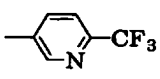
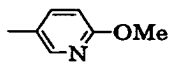
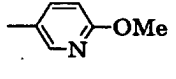
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-166	A-1	O		-	OH
III-167	A-1	O		-	OH
III-168	A-1	O		-	OH
III-169	A-1	O		-	OH
III-170	A-1	O		-	OH
III-171	A-1	O		-	OH
III-172	A-1	O		-	OH
III-173	A-1	O		-	OH

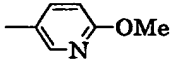
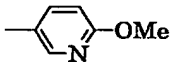
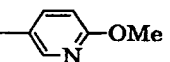
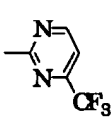
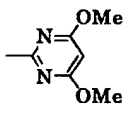
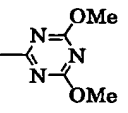
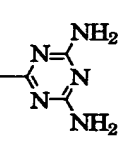
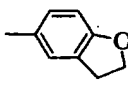
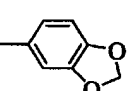
[Tabla 34]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-174	A-1	O		-	OH
III-175	A-1	O		-	OH
III-176	A-1	O		-	OH
III-177	A-1	O		-	OH
III-178	A-1	O		-	OH

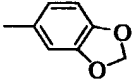
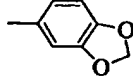
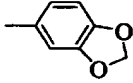
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-179	A-1	O		-	OH
III-180	A-1	O		-	OH
III-181	A-1	O		-	OH
III-182	A-1	O		-	OH
III-183	A-1	O		-	OH
III-184	A-1	O		-	OH
III-185	A-1	O		-	OH
III-186	A-1	O		-	OH
III-187	A-1	O		-	OH
III-188	A-1	O		-	OH
III-189	A-1	O		-	OH
III-190	A-2	O		-	OH

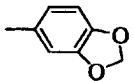
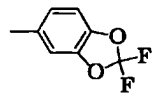
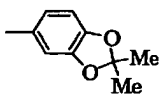
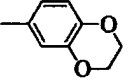
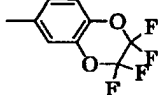
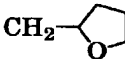
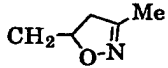
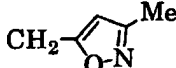
[Tabla 35]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-191	A-3	O		-	OH
III-192	A-4	O		-	OH
III-193	A-5	O		-	OH
III-194	A-1	O		-	OH
III-195	A-1	O		-	OH
III-196	A-1	O		-	OH
III-197	A-1	O		-	OH
III-198	A-1	O		-	OH
III-199	A-1	O		-	OH
III-200	A-1	O		-	OH
III-201	A-1	O		-	OH
III-202	A-1	O		-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-203	A-2	O		-	OH
III-204	A-3	O		-	OH
III-205	A-4	O		-	OH

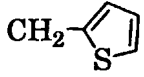
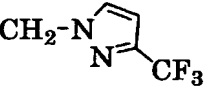
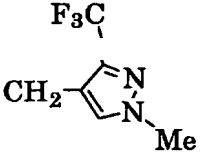
[Tabla 36]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-206	A-5	O		-	OH
III-207	A-1	O		-	OH
III-208	A-1	O		-	OH
III-209	A-1	O		-	OH
III-210	A-1	O		-	OH
III-211	A-1	O		-	OH
III-212	A-1	O		-	OH
III-213	A-1	O		-	OH
III-214	A-1	O	NH ²	-	OH

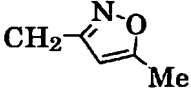
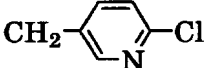
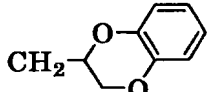
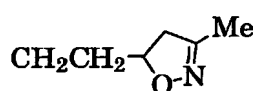
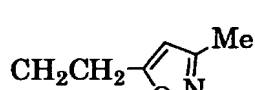
(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-215	A-1	O	NHMe	-	OH
III-216	A-1	O	NMe ₂	-	OH
III-217	A-1	O	OMe	-	OH
III-218	A-1	O	OE _t	-	OH
III-219	A-1	O	Me	6-F	OH
III-220	A-1	O	Me	6-Cl	OH
III-221	A-1	O	Me	6-OMe	OH
III-222	A-1	S	Me	-	OH
III-223	A-4	O	Me	-	S(n-Hex)
III-224	A-4	O	Me	-	SO(n-Hex)
III-225	A-4	O	Me	-	SO ₂ (n-Hex)
III-226	A-4	O	Me	-	SPh
III-227	A-4	O	Me	-	SOPh
III-228	A-4	O	Me	-	SO ₂ Ph
III-229	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	OH
III-230	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	-	OH
III-231	A-1	O	CH ₂ CH ₂ C=CH	-	OH
III-232	A-1	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	-	OH
III-233	A-1	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	-	OH

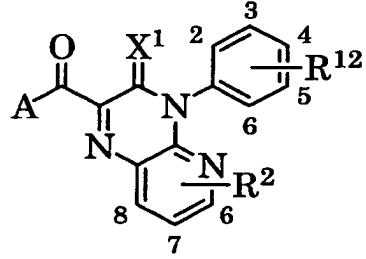
[Tabla 37]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-234	A-1	O	(2-OCHF ₂)Bn	-	OH
III-235	A-1	O	CH ₂ CH ₂ Ph	-	OH
III-236	A-1	O		-	OH
III-237	A-1	O		-	OH
III-238	A-1	O		-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-239	A-1	O		-	OH
III-240	A-1	O		-	OH
III-241	A-1	O		-	OH
III-242	A-1	O		-	OH
III-243	A-1	O		-	OH
III-244	A-1	O	Bn	8-Me	OH
III-245	A-1	O	Bn	7-Me	OH
III-246	A-1	O	Bn	6-Me	OH
III-247	A-1	O	Bn	6-OMe	OH

[Tabla 38]

					
Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-1	A-1	O	-	-	OH
IV-2	A-2	O	-	-	OH
IV-3	A-3	O	-	-	OH
IV-4	A-4	O	-	-	OH
IV-5	A-5	O	-	-	OH
IV-6	A-1	O	2-F	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-7	A-1	O	3-F	-	OH
IV-8	A-1	O	4-F	-	OH
IV-9	A-1	O	2-Cl	-	OH
IV-10	A-4	O	2-Cl	-	OH
IV-11	A-1	O	3-Cl	-	OH
IV-12	A-4	O	3-Cl	-	OH
IV-13	A-1	O	4-Cl	-	OH
IV-14	A-4	O	4-Cl	-	OH
IV-15	A-5	O	4-Cl	-	OH
IV-16	A-1	O	2-Br	-	OH
IV-17	A-1	O	3-Br	-	OH
IV-18	A-1	O	4-Br	-	OH
IV-19	A-1	O	2-Me	-	OH
IV-20	A-1	O	3-Me	-	OH
IV-21	A-1	O	4-Me	-	OH
IV-22	A-1	O	2-Et	-	OH
IV-23	A-1	O	3-Et	-	OH
IV-24	A-1	O	4-Et	-	OH
IV-25	A-1	O	2-n-Pr	-	OH
IV-26	A-1	O	3-n-Pr	-	OH
IV-27	A-1	O	4-n-Pr	-	OH
IV-28	A-1	O	2-i-Pr	-	OH
IV-29	A-1	O	3-i-Pr	-	OH
IV-30	A-1	O	4-i-Pr	-	OH
IV-31	A-1	O	2-c-Pr	-	OH
IV-32	A-1	O	3-c-Pr	-	OH
IV-33	A-1	O	4-c-Pr	-	OH
IV-34	A-1	O	2-CF ₃	-	OH

[Tabla 39]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-35	A-2	O	2-CF ₃	-	OH
IV-36	A-3	O	2-CF ₃	-	OH
IV-37	A-4	O	2-CF ₃	-	OH
IV-38	A-5	O	2-CF ₃	-	OH
IV-39	A-1	O	3-CF ₃	-	OH
IV-40	A-2	O	3-CF ₃	-	OH
IV-41	A-3	O	3-CF ₃	-	OH
IV-42	A-4	O	3-CF ₃	-	OH
IV-43	A-5	O	3-CF ₃	-	OH
IV-44	A-1	O	4-CF ₃	-	OH
IV-45	A-2	O	4-CF ₃	-	OH
IV-46	A-3	O	4-CF ₃	-	OH
IV-47	A-4	O	4-CF ₃	-	OH
IV-48	A-5	O	4-CF ₃	-	OH
IV-49	A-1	O	2-OH	-	OH
IV-50	A-1	O	3-OH	-	OH
IV-51	A-1	O	4-OH	-	OH
IV-52	A-1	O	2-OMe	-	OH
IV-53	A-2	O	2-OMe	-	OH
IV-54	A-3	O	2-OMe	-	OH
IV-55	A-4	O	2-OMe	-	OH
IV-56	A-5	O	2-OMe	-	OH
IV-57	A-1	O	3-OMe	-	OH
IV-58	A-2	O	3-OMe	-	OH
IV-59	A-3	O	3-OMe	-	OH
IV-60	A-4	O	3-OMe	-	OH
IV-61	A-5	O	3-OMe	-	OH
IV-62	A-1	O	4-OMe	-	OH
IV-63	A-2	O	4-OMe	-	OH
IV-64	A-3	O	4-OMe	-	OH
IV-65	A-4	O	4-OMe	-	OH
IV-66	A-5	O	4-OMe	-	OH
IV-67	A-1	O	2-OEt	-	OH
IV-68	A-1	O	3-OEt	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-69	A-1	O	4-OEt	-	OH
IV-70	A-1	O	2-O-n-Pr	-	OH
IV-71	A-1	O	3-O-n-Pr	-	OH
IV-72	A-1	O	4-O-n-Pr	-	OH
IV-73	A-1	O	2-O-i-Pr	-	OH
IV-74	A-1	O	3-O-i-Pr	-	OH
IV-75	A-1	O	4-O-i-Pr	-	OH

[Tabla 40]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R2	R3
IV-76	A-1	O	2-O-c-Pr	-	OH
IV-77	A-1	O	3-O-c-Pr	-	OH
IV-78	A-1	O	4-O-c-Pr	-	OH
IV-79	A-1	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	-	OH
IV-80	A-1	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	-	OH
IV-81	A-1	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	-	OH
IV-82	A-1	O	2-OCH ₂ C=CH	-	OH
IV-83	A-1	O	3-OCH ₂ C=CH	-	OH
IV-84	A-1	O	4-OCH ₂ C=CH	-	OH
IV-85	A-1	O	2-OCHF ₂	-	OH
IV-86	A-2	O	2-OCHF ₂	-	OH
IV-87	A-3	O	2-OCHF ₂	-	OH
IV-88	A-4	O	2-OCHF ₂	-	OH
IV-89	A-5	O	2-OCHF ₂	-	OH
IV-90	A-1	O	3-OCHF ₂	-	OH
IV-91	A-2	O	3-OCHF ₂	-	OH
IV-92	A-3	O	3-OCHF ₂	-	OH
IV-93	A-4	O	3-OCHF ₂	-	OH
IV-94	A-5	O	3-OCHF ₂	-	OH
IV-95	A-1	O	4-OCHF ₂	-	OH
IV-96	A-2	O	4-OCHF ₂	-	OH
IV-97	A-3	O	4-OCHF ₂	-	OH
IV-98	A-4	O	4-OCHF ₂	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-99	A-5	O	4-OCHF ₂	-	OH
IV-100	A-1	O	2-OCF ₃	-	OH
IV-101	A-1	O	3-OCF ₃	-	OH
IV-102	A-2	O	3-OCF ₃	-	OH
IV-103	A-3	O	3-OCF ₃	-	OH
IV-104	A-4	O	3-OCF ₃	-	OH
IV-105	A-5	O	3-OCF ₃	-	OH
IV-106	A-1	O	4-OCF ₃	-	OH
IV-107	A-2	O	4-OCF ₃	-	OH
IV-108	A-3	O	4-OCF ₃	-	OH
IV-109	A-4	O	4-OCF ₃	-	OH
IV-110	A-5	O	4-OCF ₃	-	OH
IV-111	A-1	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
IV-112	A-1	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH
IV-113	A-1	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	-	OH

[Tabla 41]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-114	A-1	O	2-OCH ₂ 	-	OH
IV-115	A-1	O	3-OCH ₂ 	-	OH
IV-116	A-1	O	4-OCH ₂ 	-	OH
IV-117	A-1	O	2-OC(=O)Me	-	OH
IV-118	A-1	O	3-OC(=O)Me	-	OH
IV-119	A-1	O	3-OC(=O)Me	-	OH
IV-120	A-1	O	2-SMe	-	OH
IV-121	A-1	O	3-SMe	-	OH
IV-122	A-1	O	4-SMe	-	OH
IV-123	A-1	O	2-SO ₂ Me	-	OH
IV-124	A-1	O	3-SO ₂ Me	-	OH
IV-125	A-1	O	4-SO ₂ Me	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-126	A-1	O	2-SCF ₃	-	OH
IV-127	A-1	O	3-SCF ₃	-	OH
IV-128	A-1	O	4-SCF ₃	-	OH
IV-129	A-1	O	2-NO ₂	-	OH
IV-130	A-1	O	3-NO ₂	-	OH
IV-131	A-1	O	4-NO ₂	-	OH
IV-132	A-1	O	2-NH ₂	-	OH
IV-133	A-1	O	3-NH ₂	-	OH
IV-134	A-1	O	4-NH ₂	-	OH
IV-135	A-1	O	2-CN	-	OH
IV-136	A-1	O	3-CN	-	OH
IV-137	A-1	O	4-CN	-	OH
IV-138	A-1	O	2-C(=O)Me	-	OH
IV-139	A-1	O	3-C(=O)Me	-	OH
IV-140	A-1	O	4-C(=O)Me	-	OH
IV-141	A-1	O	2-C(=O)OH	-	OH
IV-142	A-1	O	3-C(=O)OH	-	OH
IV-143	A-1	O	4-C(=O)OH	-	OH
IV-144	A-1	O	2-C(=O)OMe	-	OH
IV-145	A-1	O	3-C(=O)OMe	-	OH
IV-146	A-1	O	4-C(=O)OMe	-	OH
IV-147	A-1	O	2-CH ₂ OMe	-	OH
IV-148	A-1	O	3-CH ₂ OMe	-	OH

[Tabla 42]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-149	A-1	O	4-CH ₂ OMe	-	OH
IV-150	A-1	O	2,3-F ₂	-	OH
IV-151	A-1	O	2,4-F ₂	-	OH
IV-152	A-1	O	2,5-F ₂	-	OH
IV-153	A-1	O	2,6-F ₂	-	OH
IV-154	A-1	O	3,4-F ₂	-	OH
IV-155	A-1	O	3,5-F ₂	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-156	A-1	O	2,3-Cl ₂	-	OH
IV-157	A-1	O	2,4-Cl ₂	-	OH
IV-158	A-1	O	2,5-Cl ₂	-	OH
IV-159	A-1	O	2,6-Cl ₂	-	OH
IV-160	A-1	O	3,4-Cl ₂	-	OH
IV-161	A-1	O	3,5-Cl ₂	-	OH
IV-162	A-1	O	2-F, 3-OMe	-	OH
IV-163	A-1	O	2-Cl, 3-OMe	-	OH
IV-164	A-1	O	2-Me, 3-OMe	-	OH
IV-165	A-1	O	2,3-(OMe) ₂	-	OH
IV-166	A-1	O	3-OMe, 4-F	-	OH
IV-167	A-1	O	3-OMe, 4-Cl	-	OH
IV-168	A-1	O	3-OMe, 4-Me	-	OH
IV-169	A-1	O	3,4-(OMe) ₂	-	OH
IV-170	A-1	O	3-OMe, 6-F	-	OH
IV-171	A-1	O	3-OMe, 5-Cl	-	OH
IV-172	A-1	O	3-OMe, 5-Me	-	OH
IV-173	A-1	O	3,5-(OMe) ₂	-	OH
IV-174	A-1	O	2-F, 4-OMe	-	OH
IV-175	A-1	O	2-Cl, 4-OMe	-	OH
IV-176	A-1	O	2-Me, 4-OMe	-	OH
IV-177	A-1	O	2,4-(OMe) ₂	-	OH
IV-178	A-1	O	3-F, 4-OMe	-	OH
IV-179	A-1	O	3-Cl, 4-OMe	-	OH
IV-180	A-1	O	3-Me, 4-OMe	-	OH
IV-181	A-1	O	2-F, 5-OMe	-	OH
IV-182	A-1	O	2-Cl, 5-OMe	-	OH
IV-183	A-1	O	2-Me, 5-OMe	-	OH
IV-184	A-1	O	2,5-(OMe) ₂	-	OH
IV-185	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	-	OH
IV-186	A-1	O	-	6-F	OH
IV-187	A-1	O	4-OMe	6-F	OH

[Tabla 43]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-188	A-1	O	-	6-Cl	OH
IV-189	A-1	O	4-OMe	6-Cl	OH
IV-190	A-1	O	-	6-OMe	OH
IV-191	A-1	O	4-OMe	6-OMe	OH
IV-192	A-1	S	-	-	OH
IV-193	A-1	S	4-OMe	-	OH
IV-194	A-4	O	-	-	S(n-Hex)
IV-195	A-4	O	-	-	SO(n-Hex)
IV-196	A-4	O	-	-	SO ₂ (n-Hex)
IV-197	A-4	O	-	-	SPh
IV-198	A-4	O	-	-	SOPh
IV-199	A-4	O	-	-	SO ₂ Ph
IV-200	A-1	O	2-F,5-CF ₃	-	OH
IV-201	A-1	O	3-CF ₃ ,4-F	-	OH
IV-202	A-1	O	2-F,3-CF ₃	-	OH
IV-203	A-1	O	3-F,5-CF ₃	-	OH
IV-204	A-1	O	2,3-(Me) ₂	-	OH
IV-205	A-1	O	2,4-(Me) ₂	-	OH
IV-206	A-1	O	2,5-(Me) ₂	-	OH
IV-207	A-1	O	2,6-(Me) ₂	-	OH
IV-208	A-1	O	3,4-(Me) ₂	-	OH
IV-209	A-1	O	3,5-(Me) ₂	-	OH
IV-210	A-1	O	3,5-(CF ₃) ₂	-	OH
IV-211	A-1	O	2,6-(OMe) ₂	-	OH
IV-212	A-1	O	2-F, 3-Cl	-	OH
IV-213	A-1	O	2-F, 4-Cl	-	OH
IV-214	A-1	O	2-F, 5-Cl	-	OH
IV-215	A-1	O	3-F, 4-Cl	-	OH
IV-216	A-1	O	4-F, 2-Cl	-	OH
IV-217	A-1	O	4-F, 3-Cl	-	OH
IV-218	A-1	O	2-F, 3-Me	-	OH
IV-219	A-1	O	2-F, 4-Me	-	OH
IV-220	A-1	O	2-F, 5-Me	-	OH
IV-221	A-1	O	3-F, 2-Me	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-222	A-1	O	3-F, 4-Me	-	OH
IV-223	A-4	O	3-F, 4-Me	-	OH
IV-224	A-1	O	3-F, 5-Me	-	OH
IV-225	A-1	O	4-F, 2-Me	-	OH
IV-226	A-1	O	4-F, 3-Me	-	OH

[Tabla 44]

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-227	A-1	O	5-F, 2-Me	-	OH
IV-228	A-1	O	2-F, 4-CF ³	-	OH
IV-229	A-1	O	3-F, 4-CFg	-	OH
IV-230	A-1	O	4-F, 2-CF ₃	-	OH
IV-231	A-1	O	3-F, 2-OMe	-	OH
IV-232	A-1	O	4-F, 2-OMe	-	OH
IV-233	A-1	O	5-F, 2-OMe	-	OH
IV-234	A-1	O	2-F, 4-OCHF ₂	-	OH
IV-235	A-1	O	3-F, 4-OCHF ₂	-	OH
IV-236	A-1	O	4-F, 2-OCHF ₂	-	OH
IV-237	A-1	O	4-F, 3-CN	-	OH
IV-238	A-1	O	2-Cl, 4-Me	-	OH
IV-239	A-1	O	3-Cl, 4-Me	-	OH
IV-240	A-1	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	-	OH
IV-241	A-1	O	4-Me, 3-CF ₃	-	OH
IV-242	A-1	O	4-Me, 2-OMe	-	OH
IV-243	A-1	O	3-Me, 4-CN	-	OH
IV-244	A-1	O	4-Me, 3-CN	-	OH
IV-245	A-1	O	2,3,4-Fa	-	OH
IV-246	A-1	O	2,3,5-F ₃	-	OH
IV-247	A-1	O	2,4,5-F ₃	-	OH
IV-248	A-1	O	3,4,5-F ₃	-	OH
IV-249	A-1	O	2,3-F ₂ , 4-Me	-	OH
IV-250	A-1	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	-	OH
IV-251	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-252	A-1	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	-	OH
IV-253	A-1	O	-	7-Cl	OH
IV-254	A-1	O	-	6-Me	OH
IV-255	A-1	O	-	7-Me	OH
IV-256	A-1	O	-	8-Me	OH
IV-257	A-1	O	3-Me	8-Me	OH
IV-258	A-1	O	3-CF ₃	8-Me	OH
IV-259	A-1	O	4-OMe	8-Me	OH
IV-260	A-1	O	3-F, 4-Me	8-Me	OH
IV-261	A-4	O	3-F, 4-Me	8-Me	OH
IV-262	A-1	O	3-F, 4-OMe	8-Me	OH
IV-263	A-1	O	-	8-OMe	OH
IV-264	A-1	O	3-CF ₃	8-OMe	OH

[Tabla 45]

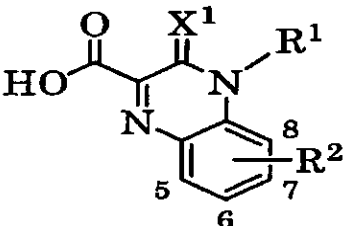
Compuesto N°	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-265	A-1	O	3-F, 4-Me	8-Cl	OH
IV-266	A-1	O	3-F, 4-Me	6-F	OH
IV-267	A-1	O	3-F, 4-Me	6-Cl	OH
IV-268	A-1	O	3-F, 4-Me	7-Me	OH
IV-269	A-1	O	3-F, 4-Me	6-Me	OH
IV-270	A-1	O	-	8-Cl	OH
IV-271	A-1	O	3-F, 4-Me	6-OMe	OH
IV-272	A-1	O	3-F, 4-Me	6-OMe	OH
IV-273	A-1	O	4-OMe	8-Cl	OH
IV-274	A-1	O	4-OMe	6,8-Me ₂	OH
IV-275	A-1	O	3-F, 4-OMe	6,8-Me ₂	OH
IV-276	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Me	OH
IV-277	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	8-Me	OH
IV-278	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6,8-Me ₂	OH
IV-279	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6,8-Me ₂	OH
IV-280	A-1	O	4-OMe	6-Cl, 8-Me	OH
IV-281	A-1	O	3-F, 4-OMe	6-Cl, 8-Me	OH

(Continuación)

Compuesto N°	A	X1	R12	R2	R3
IV-282	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-Cl, 8-Me	OH
IV-283	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-Cl, 8-Me	OH
IV-284	A-1	O	-	6-SMe	OH
IV-285	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe	OH
IV-286	A-1	O	3-F, 4-OEt	-	OH
IV-287	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl	OH

5 Ejemplos específicos preferidos de los compuestos representados por medio de la fórmula [J2] que es un intermedio de producción de la presente invención se muestra en la Tabla 46 a Tabla 81 siguientes. No obstante, no se pretende que el compuesto se encuentre limitado a estos compuestos como en el caso del compuesto de la presente invención. De manera adicional, los números del compuesto se refieren a las siguientes descripciones, y las anotaciones de las tablas tienen los mismos significados que se han mencionado anteriormente. Los compuestos marcados con un asterisco (*) son únicamente a modo de referencia y/o comparación.

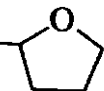
[Tabla 46]

			
Compuesto N°.	X ¹	R ¹	R ²
V-1	O	H	-
V-2	O	Me	-
V-3	O	Et	-
V-4	O	n-Pr	-
V-5	O	i-Pr	-
V-6	O	c-Pr	-
V-7	O	n-Bu	-
V-8	O	s-Bu	-
V-9	O	i-Bu	-
V-10	O	t-Bu	-
V-11	O	c-Bu	-
V-12	O	n-Pen	-
V-13	O	c-Pen	-
V-14	O	n-Hex	-

(Continuación)

Compuesto N°.	X ¹	R ¹	R ²
V-15	O	c-Hex	-
V-16	O	n-C ₇ H ₁₅	-
V-17	O	n-C ₈ H ₁₇	-
V-18	O	n-C ₉ H ₁₉	-
V-19	O	n-C ₁₀ H ₂₁	-
V-20	O	n-C ₁₁ H ₂₃	-
V-21	O	n-C ₁₂ H ₂₅	-
V-22	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
V-23	O	CH ₂ C=CH	-
V-24	O	CH ₂ CF ₃	-
V-25	O	CH ₂ CH ₂ F	-
V-26	O	CH ₂ CH ₂ Cl	-
V-27	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	-
V-28	O	CH ₂ CH=CCl ₂	-
V-29	O	CH ₂ OMe	-
V-30	O	CH ₂ OEt	-
V-31	O	CH(Me)OMe	-
V-32	O	CH(Me)OEt	-
V-33	O	CH ₂ OPh	-
V-34	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	-

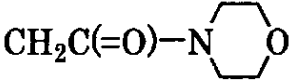
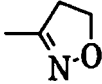
[Tabla 47]

Compuesto N°.	X ¹	R ¹	R ²
V-35	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
V-36	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	-
V-37	O	CH ₂ OCH ₂ - 	-
V-38	O	CH(Me)OCH ₂ - 	-
V-39	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
V-40	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	-
V-41	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	-

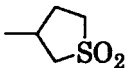
(Continuación)

Compuesto N°.	X ¹	R ¹	R ²
V-42	O	CH ₂ SMe	-
V-43	O	CH ₂ SEt	-
V-44	O	CH ₂ S-n-Pr	-
V-45	O	CH(Me)SMe	-
V-46	O	CH(Me)SEt	-
V-47	O	CH(Me)S-n-Pr	-
V-48	O	CH ₂ SOMe	-
V-49	O	CH ₂ SOEt	-
V-50	O	CH ₂ SO-n-Pr	-
V-51	O	CH ₂ SO ₂ Me	-
V-52	O	CH ₂ SO ₂ Et	-
V-53	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	-
V-54	O	CH(Me)SO ₂ Me	-
V-55	O	CH(Me)SO ₂ Et	-
V-56	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	-
V-57	O	CH ₂ CH ₂ OH	-
V-58	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-
V-59	O	CH ₂ CH ₂ OEt	-
V-60	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-
V-61	O	CH ₂ CH ₂ SMe	-
V-62	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
V-63	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-
V-64	O	CH ₂ C(=O)Me	-
V-65	O	CH ₂ C(=O)OMe	-
V-66	O	CH ₂ C(=O)OEt	-
V-67	O	CH ₂ C(=O)O-n-Pr	-
V-68	O	CH ₂ C(=O)O-i-Pr	-
V-69	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	-
V-70	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	-

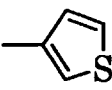
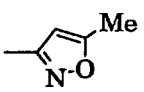
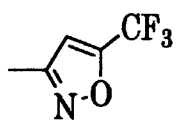
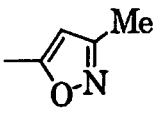
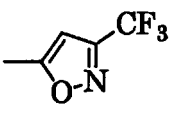
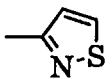
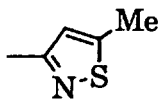
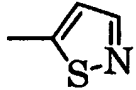
[Tabla 48]

Compuesto N°.	X ¹	R ¹	R ²
V-71	O		
V-72	O	CH ₂ CN	-
V-73	O	CH ₂ CH ₂ CN	-
V-74	O	CH(Me)CH ₂ CN	-
V-75	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	-
V-76	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	-
V-77	O	Bn	-
V-78	O	(2-F)Bn	-
V-79	O	(3-F)Bn	-
V-80	O	(4-F)Bn	-
V-81	O	(2-Cl)Bn	-
V-82	O	(3-Cl)Bn	-
V-83	O	(4-Cl)Bn	-
V-84	O	(2-Me)Bn	-
V-85	O	(3-Me)Bn	-
V-86	O	(4-Me)Bn	-
V-87	O	(2-CF ₃)Bn	-
V-88	O	(3-CF ₃)Bn	-
V-89	O	(4-CF ₃)Bn	-
V-90	O	(2-OMe)Bn	-
V-91	O	(3-OMe)Bn	-
V-92	O	(4-OMe)Bn	-
V-93	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	-
V-94	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	-
V-95	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	-
V-96	O	CH(Me)Ph	-
V-97	O		
V-98	O		-

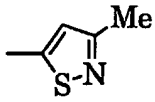
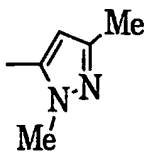
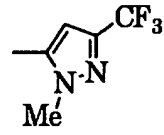
(Continuación)

Compuesto N°.	X ¹	R ¹	R ²
V-99	O		-
V-100	O		-

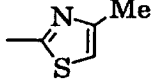
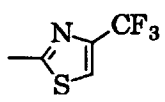
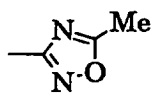
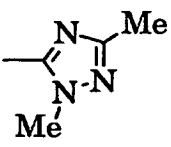
[Tabla 49]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-101	O		-
V-102	O		-
V-103	O		-
V-104	O		-
V-105	O		-
V-106	O		-
V-107	O		-
V-108	O		-
V-109	O		-

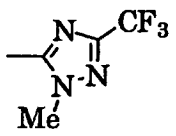
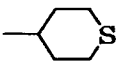
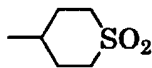
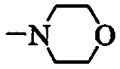
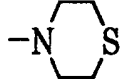
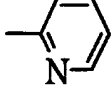
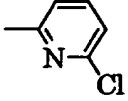
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-110	O		-
V-111	O		-
V-112	O		-

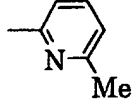
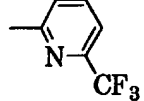
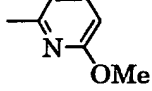
[Tabla 50]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-113	O		-
V-114	O		-
V-115	O		-
V-116	O		-
V-117	O		-
V-118	O		-

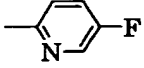
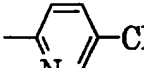
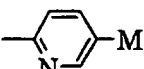
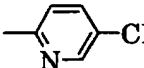
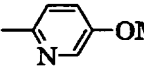
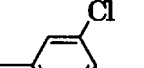
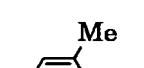
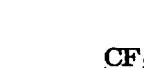
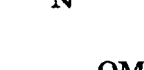
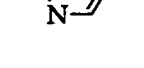
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-119	O		-
V-120	O		-
V-121	O		-
V-122	O		-
V-123	O		-
V-124	O		-
V-125	O		-
V-126	O		-

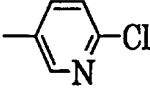
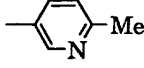
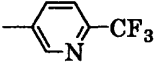
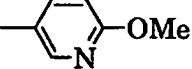
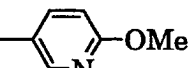
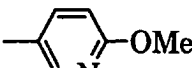
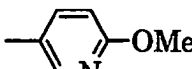
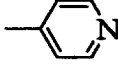
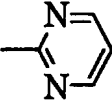
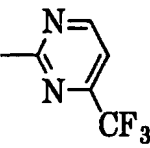
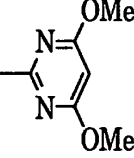
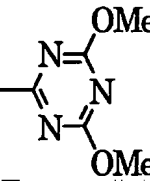
[Tabla 51]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-127	O		-
V-128	O		-
V-129	O		-

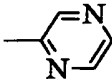
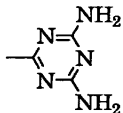
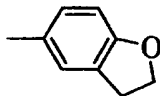
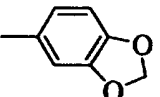
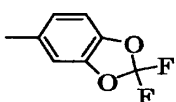
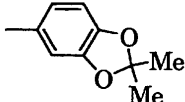
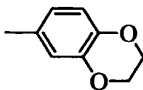
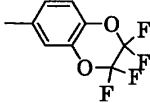
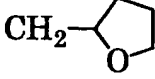
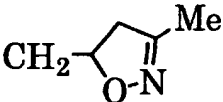
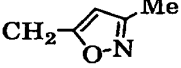
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-130	O		-
V-131	O		-
V-132	O		-
V-133	O		-
V-134	O		-
V-135	O		-
V-136	O		-
V-137	O		-
V-138	O		-
V-139	O		-

[Tabla 52]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-140	O		-
V-141	O		-
V-142	O		-
V-143	O		-
V-144	O		-
V-145	O		-
V-146	O		-
V-147	O		-
V-148	O		-
V-149	O		-
V-150	O		-
V-151	O		-

[Tabla 53]

Compuesto N°	X1	R ¹	R ²
V-152	O		-
V-153	O		-
V-154	O		-
V-155	O		-
V-156	O		-
V-157	O		-
V-158	O		-
V-159	O		-
V-160	O		-
V-161	O		-
V-162	O		-
V-163	O		-

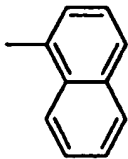
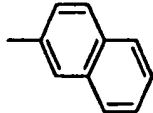
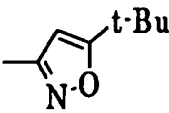
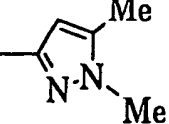
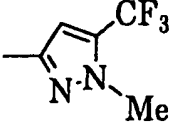
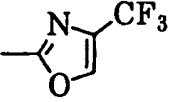
[Tabla 54]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-164	O	NHMe	-
V-165	O	NMe ₂	-
V-166	O	OMe	-
V-167	O	OEt	-
V-168	O	Me	5-F
V-169	O	Me	6-F
V-170	O	Me	7-F
V-171	O	Me	8-F
V-172	O	Me	5Cl
V-173	O	CH ₂ CH ₂ OMe	5-Cl
V-174	O	Me	6-Cl
V-175	O	CH ₂ CH ₂ OMe	6-Cl
V-176	O	Me	7-Cl
V-177	O	CH ₂ CH ₂ OMe	7-Cl
V-178	O	Me	8-Cl
V-179	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl
V-180	O	Me	7-Me
V-181	O	Me	6-CF ₃
V-182	O	Me	7-CF ₃
V-183	O	Me	6-OH
V-184	O	Me	7-OH
V-185	O	Me	6-OMe
V-186	O	Me	7-OMe
V-187	O	Me	6-OCF ₃
V-188	O	Me	7-OCF ₃
V-189	O	Me	5-SMe
V-190	O	Me	6-SMe
V-191	O	Me	7-SMe
V-192	O	Me	8-SMe
V-193	O	Me	5-SO ₂ Me
V-194	O	Me	6-SO ₂ Me
V-195	O	Me	7-SO ₂ Me
V-196	O	Me	8-SO ₂ Me

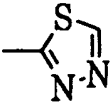
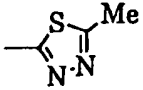
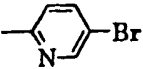
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-197	O	Me	6-NO ₂
V-198	O	Me	7-NO ₂
V-199	O	Me	6-NH ₂
V-200	O	Me	7-NH ₂

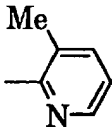
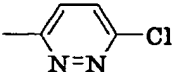
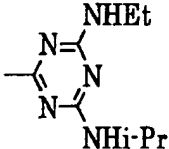
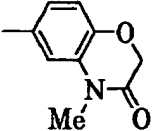
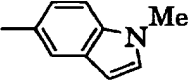
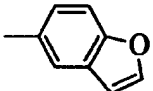
[Tabla 55]

Compuesto N°	X1	R ¹	R ²
V-201	O	Me	7-CN
V-202	O	Me	6,7-Cl ₂
V-203	O	Me	6,7-Me ₂
V-204	S	Me	-
V-205 *	O		
V-206 *	O		
V-207	O		
V-208	O		
V-209	O		
V-210	O		

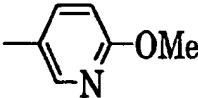
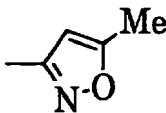
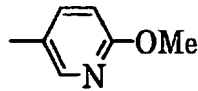
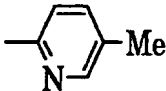
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-211	O		
V-212	O		
V-213	O		

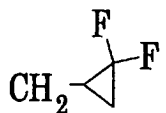
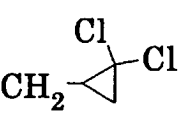
[Tabla 56]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-214	O		-
V-215	O		-
V-216	O		-
V-217	O		-
V-218	O		-
V-219	O		-
V-220	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	-

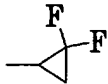
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-221	O		5-F
V-222	O	Bn	6-F
V-223	O		6-F
V-224	O	Me	5-CH ₂ OMe
V-225	O		5,7-F ₂
V-226	O		7-Cl
V-227	O	CH ₂ -C-Pr	-
V-228	O	CH ₂ -C-Bu	-
V-229	O	CH ₂ -C-Pen	-
V-230	O	CH ₂ O-C-Pen	-

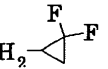
[Tabla 57]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-231	O	CH ₂ CH ₂ NH ₂	-
V-232	O	CH ₂ CH ₂ NHEt	-
V-233	O	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	-
V-234	O	CH ₂ CH ₂ NEt ₂	-
V-235	O	CH ₂ CH ₂ CHO	-
V-236	O		-
V-237	O		-
V-238	O	CH ₂ OCH ₂ -C-Pr	-
V-239	O	CH ₂ SPh	-

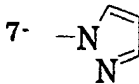
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-240	O	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4\text{N}$	-
V-241	O	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CF}_3$	-
V-242	O	$\text{CH}_2\text{SOCH}_2\text{CF}_3$	-
V-243	O	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	-
V-244	O	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	-
V-245	O	CH_2SOPh	-
V-246	O	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Ph}$	-
V-247	O	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	-
V-248	O	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SOMe}$	-
V-249	O	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{OEt})_2$	-
V-250	O	$\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})=\text{NOMe}$	-
V-251	O	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{ON}=\text{CMe}_2$	-
V-252	O	Me	7-CH=CMe ₂
V-253	O	Me	7-C≡CMe
V-254	O	Me	7-CH ₂ -c-Pr
V-255	O	Me	7-C(Me)=CF ₂
V-256	O	Me	7- 
V-257	O	Me	7-O-c-Pr

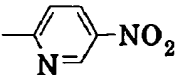
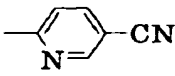
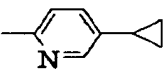
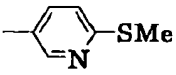
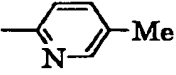
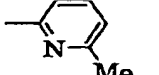
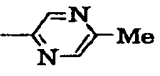
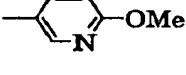
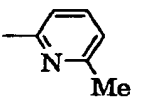
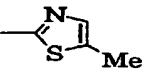
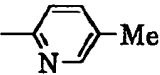
[Tabla 58]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-258	O	Me	7- 
V-259	O	Me	7-OCH ₂ -c-Pr
V-260	O	Me	7-OCH ₂ OMe
V-261	O	Me	7-OC(=O)Me
V-262	O	Me	7-SOMe
V-263	O	Me	7-SCF ₃
V-264	O	Me	7-SOCH ₂ CF ₃
V-265	O	Me	7-SO ₂ CH ₂ CF ₃
V-266	O	Me	7-NMe ₂

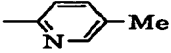
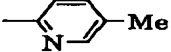
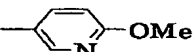
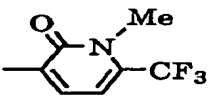
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-267	O	Me	7-NHC(=O)Me
V-268	O	Me	7-CH ₂ OH
V-269	O	Me	7-CH(OEt) ₂
V-270	O	Me	7-CH ₂ SMe
V-271	O	Me	7-CH ₂ SOMe
V-272	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ Me
V-273	O	Me	7-CH ₂ SCHF ₂
V-274	O	Me	7-CH ₂ SOCHF ₂
V-275	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ CHF ₂
V-276	O	Me	7-CH ₂ CN
V-277	O	Me	7-C(Me)=NOMe
V-278	O	Me	7-C(=O)NH ₂
V-279	O	Me	7- 
V-280	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-F)	I
V-281	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Cl)	-
V-282	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-NO ₂)	-
V-283	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CN)	-
V-284	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Me)	-
V-285	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CF ₃)	-
V-286	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OMe)	-
V-287	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OCF ₃)	-
V-288	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SMe)	-
V-289	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SO ₂ Me)	-
V-290	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SCF ₃)	-
V-291	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CO ₂ Me)	-
V-292	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-COMe)	-
V-293	O	(2-NO ₂)Bn	-
V-294	O	(2-CN)Bn	-
V-295	O	(3-SMe)Bn	-

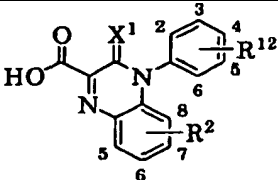
[Tabla 59]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-296	O	(3-SO ₂ Me)Bn	-
V-297	O	(3-SCF ₃)Bn	-
V-298	O	(3-CO ₂ Me)Bn	-
V-299	O	(3-COMe)Bn	-
V-300	O	(3-OMe)Bn	-
V-301	O		-
V-302	O		-
V-303	O		-
V-304	O		-
V-305	O	Et	5-Cl
V-306	O	n-Bu	5-Cl
V-307	O		7-Me
V-308	O		6-CF ₃
V-309	O		-
V-310	O		5-Cl
V-311	O		6-F
V-312	O		-
V-313	O	NHC(=O)O-t-Bu	-
V-314	O	N(Me)C(=O)O-t-Bu	-
V-315	O		5-F

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
V-316	O		5-Cl
V-317	O		5-Me
V-318	O		5-Me
V-319	O		-

[Tabla 60]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-1*	O	-	-
VI-2	O	2-F	-
VI-3	O	3-F	-
VI-4	O	4-F	-
VI-5	O	2-Cl	-
VI-6	O	3-Cl	-
VI-7	O	4-Cl	-
VI-8	O	2-Br	-
VI-9	O	3-Br	-
VI-10	O	4-Br	-
VI-11	O	2-Me	-
VI-12	O	3-Me	-
VI-13	O	4-Me	-
VI-14	O	2-Et	-
VI-15	O	3-Et	-
VI-16	O	4-Et	-
VI-17	O	2-n-Pr	-
VI-18	O	3-n-Pr	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-19	O	4-n-Pr	-
VI-20	O	2-i-Pr	-
VI-21	O	3-i-Pr	-
VI-22	O	4-i-Pr	-
VI-23	O	2-c-Pr	-
VI-24	O	3-c-Pr	-
VI-25	O	4-c-Pr	-
VI-26	O	2-CF ₃	-
VI-27	O	3-CF ₃	-
VI-28	O	4-CF ₃	-
VI-29	O	2-OH	-
VI-30	O	3-OH	-
VI-31	O	4-OH	-
VI-32	O	2-OMe	-
VI-33	O	3-OMe	-
VI-34	O	4-OMe	-
VI-35	O	2-OEt	-
VI-36	O	3-OEt	-

[Tabla 61]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-37	O	4-OEt	-
VI-38	O	2-O-n-Pr	-
VI-39	O	3-O-n-Pr	-
VI-40	O	4-O-n-Pr	-
VI-41	O	2-O-i-Pr	-
VI-42	O	3-O-i-Pr	-
VI-43	O	4-O-i-Pr	-
VI-44	O	2-O-c-Pr	-
VI-45	O	3-O-c-Pr	-
VI-46	O	4-O-c-Pr	-
VI-47	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	-
VI-48	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-49	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	-
VI-50	O	2-OCH ₂ C≡CH	-
VI-51	O	3-OCH ₂ C≡CH	-
VI-52	O	4-OCH ₂ C≡CH	-
VI-53	O	2-OCHF ₂	-
VI-54	O	3-OCHF ₂	-
VI-55	O	4-OCHF ₂	-
VI-56	O	2-OCF ₃	-
VI-57	O	3-OCF ₃	-
VI-58	O	4-OCF ₃	-
VI-59	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VI-60	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VI-61	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VI-62	O	2-OCH ₂ 	-
VI-63	O	3-OCH ₂ 	-
VI-64	O	4-OCH ₂ 	-
VI-65	O	2-OC(=O)Me	-
VI-66	O	3-OC(=O)Me	-
VI-67	O	3-OC(=O)Me	-
VI-68	O	2-SMe	-
VI-69	O	3-SMe	-
VI-70	O	4-SMe	-

[Tabla 62]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-71	O	2-SO ₂ M	-
VI-72	O	3-SO ₂ Me	-
VI-73	O	4-SO ₂ Me	-
VI-74	O	2-SCF ₃	-
VI-75	O	3-SCF ₃	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-76	O	4-SCF ₃	-
VI-77	O	2-NO ₂	-
VI-78	O	3-NO ₂	-
VI-79	O	4-NO ₂	-
VI-80	O	2-NH ₂	-
VI-81	O	3-NH ₂	-
VI-82	O	4-NH ₂	-
VI-83	O	2-CN	-
VI-84	O	3-CN	-
VI-85	O	4-CN	-
VI-86	O	2-C(=O)Me	-
VI-87	O	3-C(=O)Me	-
VI-88	O	4-C(=O)Me	-
VI-89	O	2-C(=O)OH	-
VI-90	O	3-C(=O)OH	-
VI-91	O	4-C(=O)OH	-
VI-92	O	2-C(=O)OMe	-
VI-93	O	3-C(=O)OMe	-
VI-94	O	4-C(=O)OMe	-
VI-95	O	2-CH ₂ OMe	-
VI-96	O	3-CH ₂ OMe	-
VI-97	O	4-CH ₂ OMe	-
VI-98	O	2,3-F ₂	-
VI-99	O	2,4-F ₂	-
VI-100	O	2,5-F ₂	-
VI-101	O	2,6-F ₂	-
VI-102	O	3,4-F ₂	-
VI-103	O	3,5-F ₂	-
VI-104	O	2,3-Cl ₂	-
VI-105	O	2,4-Cl ₂	-
VI-106	O	2,5-Cl ₂	-
VI-107	O	2,6-Cl ₂	-
VI-108	O	3,4-Cl ₂	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-109	O	3,5-Cl ₂	-

[Tabla 63]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-110	O	2-F, 3-OMe	-
VI-111	O	2-Cl, 3-OMe	-
VI-112	O	2-Me, 3-OMe	-
VI-113	O	2,3-(OMe) ₂	-
VI-114	O	3-OMe, 4-F	-
VI-115	O	3-OMe, 4-Cl	-
VI-116	O	3-OMe, 4-Me	-
VI-117	O	3,4-(OMe) ₂	-
VI-118	O	3-OMe, 5-F	-
VI-119	O	3-OMe, 5-Cl	-
VI-120	O	3-OMe, 5-Me	-
VI-121	O	3,5-(OMe) ₂	-
VI-122	O	2-F, 4-OMe	-
VI-123	O	2-Cl, 4-OMe	-
VI-124	O	2-Me, 4-OMe	-
VI-125	O	2,4-(OMe) ₂	-
VI-126	O	3-F, 4-OMe	-
VI-127	O	3-Cl, 4-OMe	-
VI-128	O	3-Me, 4-OMe	-
VI-129	O	2-F, 5-OMe	-
VI-130	O	2-Cl, 5-OMe	-
VI-131	O	2-Me, 5-OMe	-
VI-132	O	2,6-(OMe) ₂	-
VI-133	O	3,4,5-(OMe) _a	-
VI-134	O	4-OMe	5-F
VI-135	O	4-OMe	6-F
VI-136	O	4-OMe	7-F
VI-137	O	4-OMe	8-F
VI-138*	O	-	5-Cl
VI-139*	O	-	6 Cl

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-140*	O	-	7-Cl
VI-141*	O	-	8-Cl
VI-142	O	4-OMe	5-Cl
VI-143	O	4-OMe	6-Cl
VI-144	O	4-OMe	7-Cl
VI-145	O	4-OMe	8-Cl
VI-146*	S	-	-
VI-147	O	4-OCH ₂ CN	-
VI-148	O	3-OCH ₂ -c-Pr	-

[Tabla 64]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-149	O	3-OCH ₂ CF ₃	-
VI-160	O	4-OCH _a -c-Pr	-
VI-151	O	4-OCH _a CF ₃	-
VI-152	O	4-NMe ₂	-
VI-153	O	3,4-Me ₂	-
VI-164	O	2-F, 4-Me	-
VI-156	O	3-F, 4 Me	-
VI-156	O	3-Me, 4-F	-
VI-157	O	2-Cl, 4-Me	-
VI-168	O	3-Cl, 4-Me	-
VI-159	O	3-OEt, 4-OMe	-
VI-160	O	2,3,4-(OMe) ₃	-
VI-161	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	-
VI-162	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-
VI-163	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	-
VI-164	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-
VI-165	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ -CH ₂)-	-
VI-166	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	-
VI-167	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F
VI-168	O	2, 3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-
VI-169	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-170	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	-
VI-171*	O	-	5-F
VI-172	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F
VI-173	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F
VI-174	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F
VI-175*	O	-	6-F
VI-176	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F
VI-177	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F
VI-178	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F
VI-179*	O	-	7-F
VI-180	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F
VI-181*	O	-	8-F
VI-182*	O	-	6-Me
VI-183	O	4-OMe	5-Me
VI-184	O	4-OMe	6-Me
VI-185	O	4-OMe	7-Me
VI-186	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me

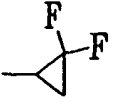
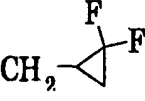
[Tabla 65]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-187 *	O	-	6-CF ₃
VI-188 *	O	-	6-OMe
VI-189	O	4-OMe	6-OMe
VI-190 *	O	-	7-OMe
VI-191	O	4-OMe	7-OMe
VI-192	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
VI-193	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
VI-194 *	O	-	8-OMe
VI-195	O	4-OMe	8-OMe
VI-196	O	4-OMe	5,6-F ₂
VI-197	O	4-OMe	5,7-F ₂
VI-198 *	O	-	6,7-F ₂
VI-199 *	O	-	6,8-F ₂

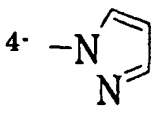
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-200	O	4-OMe	5,7-Cl ₂
VI-201	O	4-OMe	6-F, 7-OMe
VI-202 *	O	-	7-c-Pr
VI-203 *	O	-	7-OCH ₂ CH=CH ₂
VI-204 *	O	-	7-OCH ₂ C≡CH
VI-205 *	O	-	7-NHMe
VI-206 *	O	-	7-C(=O)H
VI-207*	O	-	6-C(=O)Me
VI-208*	O	-	7-C(=O)OH
VI-209 *	O	-	7-C(=O)OMe
VI-210 *	O	-	7-C(=O)OEt
VI-211 *	O	-	7-C(=O)NHNe
VI-212 *	O	-	7-C(=O)NMe ₂
VI-213 *	O	-	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)-
VI-214*	O	-	6,7-(OCH ₂ O)-
VI-215	O	4-OMe	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)-
VI-216	O	4-OMe	6,7-(OCH ₂ O)-
VI-217	O	2-CONHMe	-
VI-218	O	2-CONMe ₂	-
VI-219	O	2-NHCOMe	-
VI-220	O	4-CH ₂ -c-Pr	-
VI-221	O	4-CH=CH ₂	-
VI-222	O	4-C≡CMe	-
VI-223	O	3-CH=CF ₂	-

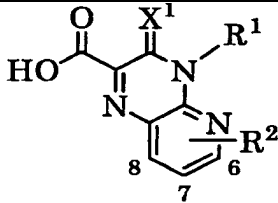
[Tabla 66]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-224	O	3- 	-
VI-225	O	4- 	-
VI-226	O	4-CH ₂ OH	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VI-227	O	4-CH ₂ SMe	-
VI-228	O	4-CH ₂ SOMe	-
VI-229	O	4-CH ₂ SO ₂ Me	-
VI-230	O	4-CH ₂ SCHF ₂	-
VI-231	O	4-CH ₂ SOCHF ₂	-
VI-232	O	4-CH ₂ SO ₂ CHF ₂	-
VI-233	O	4-CH ₂ CN	-
VI-234	O	4-NHMe	-
VI-235	O	4-OCH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
VI-236	O	4-C(Me)=NOMe	-
VI-237	O	2-CONH ₂	-
VI-238	O	4- 	-
VI-239	O	3-F, 4-OMe	5-Cl
VI-240	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe
VI-241 *	O	-	7-CF ₃
VI-242	O	4-F	7-OMe
VI-243	O	4-OCHF ₂	7-OMe
VI-244	O	4-Me	7-OMe
VI-245	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6,8-F ₂
VI-246	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	8-F
VI-247	O	4-OMe	5-Br
VI-248	O	4-F	5-F
VI-249	O	3-F, 4-OEt	-

[Tabla 67]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-1	O	H	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-2	O	Me	-
VII-3	O	Et	-
VII-4	O	n-Pr	-
VII-5	O	i-Pr	-
VII-6	O	c-Pr	-
VII-7	O	n-Bu	-
VII-8	O	s-Bu	-
VII-9	O	i-Bu	-
VII-10	O	t-Bu	-
VII-11	O	c-Bu	-
VII-12	O	n-Pen	-
VII-13	O	c-Pen	-
VII-14	O	n-Hex	-
VII-15	O	c-Hex	-
VII-16	O	n-C ₇ H ₁₅	-
VII-17	O	n-C ₈ H ₁₇	-
VII-18	O	n-C ₉ H ₁₉	-
VII-19	O	n-C ₁₀ H ₂₁	-
VII-20	O	n-C ₁₁ H ₂₃	-
VII-21	O	n-C ₁₂ H ₂₅	-
VII-22	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
VII-23	O	CH ₂ C≡CH	-
VII-24	O	CH ₂ CF ₃	-
VII-25	O	CH ₂ CH ₂ F	-
VII-26	O	CH ₂ CH ₂ Cl	-
VII-27	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	-
VII-28	O	CH ₂ CH=CCl ₂	-
VII-29	O	CH ₂ OMe	-
VII-30	O	CH ₂ OEt	-
VII-31	O	CH(Me)OMe	-
VII-32	O	CH(Me)OEt	-
VII-33	O	CH ₂ OPh	-

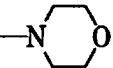
[Tabla 68]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-34	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VII-35	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
VII-36	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	-
VII-37	O	CH ₂ OCH ₂ - 	-
VII-38	O	CH(Me)OCH ₂ - 	-
VII-39	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
VII-40	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	-
VII-41	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	-
VII-42	O	CH ₂ SMe	-
VII-43	O	CH ₂ SMe	-
VII-44	O	CH ₂ SEt	-
VII-45	O	CH ₂ S-n-Pr	-
VII-46	O	CH(Me)SMe	-
VII-47	O	CH(Me)SEt	-
VII-48	O	CH(Me)S-n-Pr	-
VII-49	O	CH ₂ SOMe	-
VII-50	O	CH ₂ SOEt	-
VII-51	O	CH ₂ SO-n-Pr	-
VII-52	O	CH ₂ SO ₂ Me	-
VII-53	O	CH ₂ SO ₂ Et	-
VII-54	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	-
VII-55	O	CH(Me)SO ₂ Me	-
VII-56	O	CH(Me)SO ₂ Et	-
VII-57	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	-
VII-58	O	CH ₂ CH ₂ OH	-
VII-59	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-
VII-60	O	CH ₂ CH ₂ OEt	-
VII-61	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-
VII-62	O	CH ₂ CH ₂ SMe	-
VII-63	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
VII-64	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-

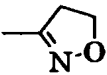
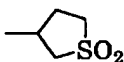
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-65	O	CH ₂ C(=O)Me	-
VII-66	O	CH ₂ C(=O)OMe	-

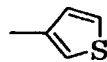
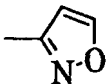
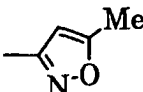
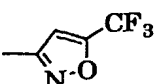
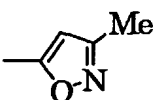
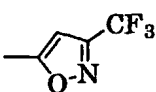
[Tabla 69]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-67	O	CH ₂ C(=O)OEt	-
VII-68	O	CH ₂ C(=O)On-Pr	-
VII-69	O	CH ₂ C(=O)Oi-Pr	-
VII-70	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	-
VII-71	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	-
VII-72	O	CH ₂ C(=O)—N 	-
VII-73	O	CH ₂ CN	-
VII-74	O	CH ₂ CH ₂ CN	-
VII-75	O	CH(Me)CH ₂ CN	-
VII-76	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	-
VII-77	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	-
VII-78	O	Bn	-
VII-79	O	(2-F)Bn	-
VII-80	O	(3-F)Bn	-
VII-81	O	(4-F)Bn	-
VII-82	O	(2-Cl)Bn	-
VII-83	O	(3-Cl)Bn	-
VII-84	O	(4-Cl)Bn	-
VII-85	O	(2-Me)Bn	-
VII-86	O	(3-Me)Bn	-
VII-87	O	(4-Me)Bn	-
VII-88	O	(2-CFa)Bn	-
VII-89	O	(3-CF ₃)Bn	-
VII-90	O	(4-CF ₃)Bn	-
VII-91	O	(2-OMe)Bn	-
VII-92	O	(3-OMe)Bn	-
VII-93	O	(4-OMe)Bn	-

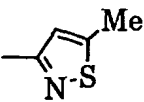
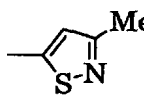
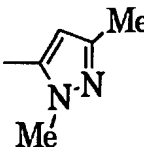
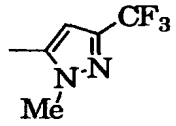
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-94	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	-
VII-95	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	-
VII-96	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	-
VII-97	O	CH(Me)Ph	-
VII-98	O		-
VII-99	O		-
VII-100	O		-

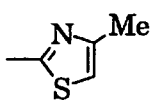
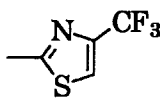
[Tabla 70]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-101	O		-
VII-102	O		-
VII-103	O		-
VII-104	O		-
VII-105	O		-
VII-106	O		-
VII-107	O		-

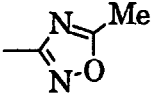
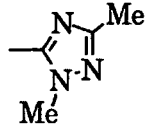
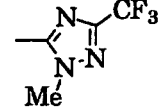
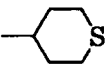
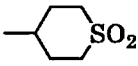
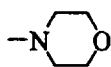
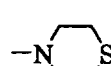
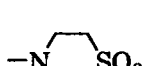
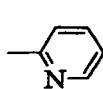
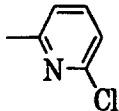
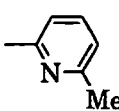
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-108	O		-
VII-109	O		-
VII-110	O		-
VII-111	O		-
VII-112	O		-
VII-113	O		-
VII-114	O		-

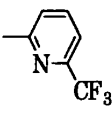
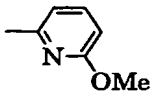
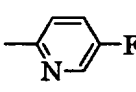
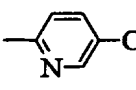
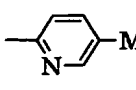
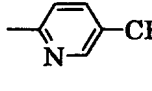
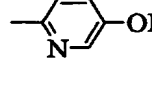
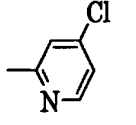
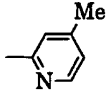
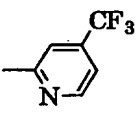
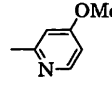
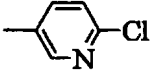
[Tabla 71]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-115	O		-
VII-116	O		-
VII-117	O		-

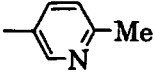
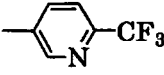
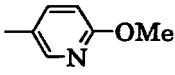
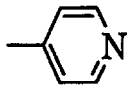
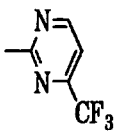
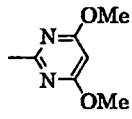
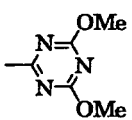
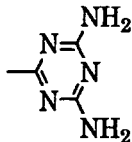
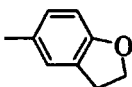
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-118	O		-
VII-119	O		-
VII-120	O		-
VII-121	O		-
VII-122	O		-
VII-123	O		-
VII-124	O		-
VII-125	O		-
VII-126	O		-
VII-127	O		-
VII-128	O		-

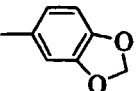
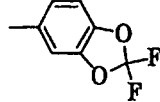
[Tabla 72]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-129	O		-
VII-130	O		-
VII-131	O		-
VII-132	O		-
VII-133	O		-
VII-134	O		-
VII-135	O		-
VII-136	O		-
VII-137	O		-
VII-138	O		-
VII-139	O		-
VII-140	O		-
VII-141	O		-

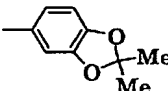
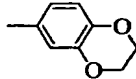
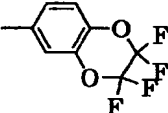
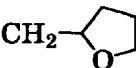
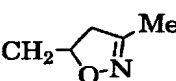
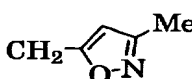
[Tabla 73]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-142	O		-
VII-143	O		-
VII-144	O		-
VII-145	O		-
VII-146	O		-
VII-147	O		-
VII-148	O		-
VII-149	O		-
Yin-150	O		-
VII-151	O		-
VII-152	O		-

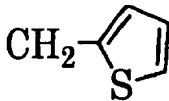
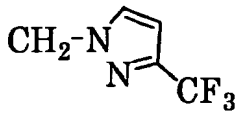
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-153	O		-
VII-154	O		-

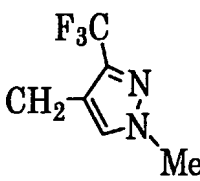
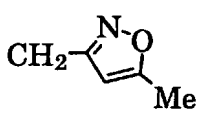
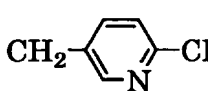
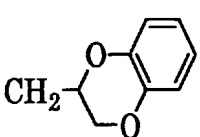
[Tabla 74]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-155	O		-
VII-156	O		-
VII-157	O		-
VII-158	O		-
VII-159	O		-
VII-160	O		-
VII-161	O	NH ₂	-
VII-162	O	NHMe	-
VII-163	O	NMe ₂	-
VII-164	O	OMe	-
VII-165	O	OEt	-
VII-166	O	Me	6-F
VII-167	O	Me	6-Cl

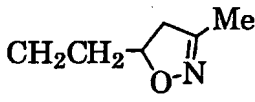
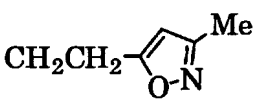
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-168	O	Me	6-OMe
VII-169	S	Me	-
VII-170	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-
VII-171	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	-
VII-172	O	CH ₂ CH ₂ C≡CH	-
VII-173	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	-
VII-174	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	-
VII-175	O	(2-OCHF ₂)Bn	-
VII-176	O	CH ₂ CH ₂ Ph	-
VII-177	O		-
VII-178	O		-

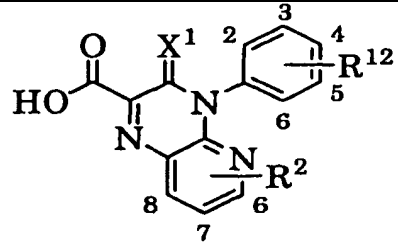
[Tabla 75]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-179	O		-
VII-180	O		-
VII-181	O		-
VII-182	O		-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
VII-183	O		-
VII-184	O		-
VII-185	O	Bn	8-Me
VII-186	O	Bn	7-Me
VII-187	O	Bn	6-Me

[Tabla 76]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-1*	O	-	-
VIII-2	O	2-F	-
VIII-3	O	3-F	-
VIII-4	O	4-F	-
VIII-5	O	2-Cl	-
VIII-6	O	3-Cl	-
VIII-7	O	4-Cl	-
VIII-8	O	2-Br	-
VIII-9	O	3-Br	-
VIII-10	O	4-Br	-
VIII-11	O	2-Me	-
VIII-12	O	3-Me	-
VIII-13	O	4-Me	-
VIII-14	O	2-Et	-
VIII-15	O	3-Et	-
VIII-16	O	4-Et	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-17	O	2-n-Pr	-
VIII-18	O	3-n-Pr	-
VIII-19	O	4-n-Pr	-
VIII-20	O	2-i-Pr	-
VIII-21	O	3-i-Pr	-
VIII-22	O	4-i-Pr	-
VIII-23	O	2-c-Pr	-
VIII-24	O	3-c-Pr	-
VIII-26	O	4-c-Pr	-
VIII-26	O	2-CF ₃	-
VIII-27	O	3-CF ₃	-
VIII-28	O	4-CF ₃	-
VIII-29	O	2-OH	-
VIII-30	O	3-OH	-
VIII-31	O	4-OH	-

[Tabla 77]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-32	O	2-OMe	-
VIII-33	O	3-OMe	-
VIII-34	O	4-OMe	-
VIII-35	O	2-OEt	-
VIII-36	O	3-OEt	-
VIII-37	O	4-OEt	-
VIII-38	O	2-O-n-Pr	-
VIII-39	O	3-O-n-Pr	-
VIII-40	O	4-O-n-Pr	-
VIII-41	O	2-O-i-Pr	-
VIII-42	O	3-O-i-Pr	-
VIII-43	O	4-O-i-Pr	-
VIII-44	O	2-O-c-Pr	-
VIII-45	O	3-O-c-Pr	-
VIII-46	O	4-O-c-Pr	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-47	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	-
VIII-48	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	-
VIII-49	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	-
VIII-50	O	2-OCH ₂ C≡CH	-
VIII-51	O	3-OCH ₂ C≡CH	-
VIII-52	O	4-OCH ₂ C≡CH	-
VIII-53	O	2-OCHF ₂	-
VIII-54	O	3-OCHF ₂	-
VIII-55	O	4-OCHF ₂	-
VIII-56	O	2-OCF ₃	-
VIII-57	O	3-OCF ₃	-
VIII-58	O	4-OCF ₃	-
VIII-59	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VIII-60	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VIII-61	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	-
VIII-62	O	2-OCH ₂ 	-
VIII-63	O	3-OCH ₂ 	-
VIII-64	O	4-OCH ₂ 	-

[Tabla 78]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-65	O	2-OC(=O)Me	-
VIII-66	O	3-OC(=O)Me	-
VIII-67	O	3-OC(=O)Me	-
VIII-68	O	2-SMe	-
VIII-69	O	3-SMe	-
VIII-70	O	4-SMe	-
VIII-71	O	2-SO ₂ Me	-
VIII-72	O	3-SO ₂ Me	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-73	O	4-SO ₂ Me	-
VIII-74	O	2-SCF ₃	-
VIII-75	O	3-SCF ₃	-
VIII-76	O	4-SCF ₃	-
VIII-77	O	2-NO ₂	-
VIII-78	O	3-NO ₂	-
VIII-79	O	4-NO ₂	-
VIII-80	O	2-NH ₂	-
VIII-81	O	3-NH ₂	-
VIII-82	O	4-NH ₂	-
VIII-83	O	2-CN	-
VIII-84	O	3-CN	-
VIII-85	O	4-CN	-
VIII-86	O	2-C(=O)Me	-
VIII-87	O	3-C(=O)Me	-
VIII-88	O	4-C(=O)Me	-
VIII-89	O	2-C(=O)OH	-
VIII-90	O	3-C(=O)OH	-
VIII-91	O	4-C(=O)OH	-
VIII-92	O	2-C(=O)OMe	-
VIII-93	O	3-C(=O)OMe	-
VIII-94	O	4-C(=O)OMe	-
VIII-95	O	2-CH ₂ OMe	-
VIII-96	O	3-CH ₂ OMe	-
VIII-97	O	4-CH ₂ OMe	-
VIII-98	O	2,3-F ₂	-
VIII-99	O	2,4-F ₂	-

[Tabla 79]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-100	O	2,5-F ₂	-
VIII-101	O	2,6-F ₂	-
VIII-102	O	3,4-F ₂	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-103	O	3,5-F ₂	-
VIII 104	O	2,3-Cl ₂	-
VIII-105	O	2,4-Cl ₂	-
VIII-106	O	2,5-Cl ₂	-
VIII-107	O	2,6-Cl ₂	-
VIII-108	O	3,4-Cl ₂	-
VIII-109	O	3,5-Cl ₂	-
VIII-110	O	2-F, 3-OMe	-
VIII-111	O	2-Cl, 3-OMe	-
VIII-112	O	2-Me, 3-OMe	-
VIII-113	O	2,3-(OMe) ₂	-
VIII-114	O	3-OMe, 4-F	-
VIII-115	O	3-OMe, 4-Cl	-
VIII-116	O	3-OMe, 4-Me	-
VIII-117	O	3,4-(OMe) ₂	-
VIII-118	O	3-OMe, 5-F	-
VIII-119	O	3-OMe, 6-Cl	-
VIII-120	O	3-OMe, 5-Me	-
VIII-121	O	3,5-(OMe) ₂	-
VIII-122	O	2-F, 4-OMe	-
VIII-123	O	2-Cl, 4-OMe	-
VIII-124	O	2-Me, 4-OMe	-
VIII-125	O	2,4-(OMe) ₂	-
VIII-126	O	3-F, 4-OMe	-
VIII-127	O	3-Cl, 4-OMe	-
VIII-128	O	3-Me, 4-OMe	-
VIII-129	O	2-F, 5-OMe	-
VIII-130	O	2-Cl, 5-OMe	-
VIII-131	O	2-Me, 5-OMe	-
VIII-132	O	2,5-(OMe) ₂	-
VIII-133	O	3,4,5-(OMe) ₃	-
VIII-134*	O	-	6-F
VIII-135	O	4-OMe	6-F

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-136*	O	-	6-Cl

[Tabla 80]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-137	O	4-OMe	6-Cl
VIII-138 *	O	-	6-OMe
VIII-139	O	4-OMe	6-OMe
VIII-140 *	S	-	-
VIII-141	S	4-OMe	-
VIII-142	O	2-F,5-CF ₃	-
VIII-143	O	3-CF ₃ ,4-F	-
VIII-144	O	2-F,3-CF ₃	-
VIII-145	O	3-F,5-CF ₃	-
VIII-146	O	2,3-(MC) ₂	-
VIII-147	O	2,4-(Me) ₂	-
VIII 148	O	2,5-(Me) ₂	-
VIII-149	O	2,6-(Me) ₂	-
VIII-150	O	3,4-(Me) ₂	-
VIII-151	O	3,5-(Me) ₂	-
VIII-152	O	3,5-(CF ₃) ₂	-
VIII-153	O	2,6-(OMe) ₂	-
VIII-164	O	2-F, 3-Cl	-
VIII-155	O	2-F, 4-Cl	-
VIII-156	O	2-F, 5 Cl	-
VIII-157	O	3-F, 4-Cl	-
VIII-158	O	4-F, 2-Cl	-
VIII-169	O	4-F, 3-Cl	-
VIII-160	O	2-F, 3-Me	-
VIII-161	O	2-F, 4-Me	-
VIII-162	O	2-F, 5-Me	-
VIII-163	O	3-F, 2-Me	-
VIII-164	O	3-F, 4-Me	-
VIII-166	O	3-F, 5-Me	-
VIII-166	O	4-F, 2-Me	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-167	O	4-F, 3-Me	-
VIII-168	O	5-F, 2-Me	-
VIII-169	O	2-F, 4-CF ₃	-
VIII-170	O	3-F, 4-CF ₃	-
VIII-171	O	4-F, 2-CF ₃	-
VIII-172	O	3-F, 2-OMe	-
VIII-173	O	4-F, 2-OMe	-

[Tabla 81]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-174	O	6-F, 2-OMe	-
VIII-175	O	2-F, 4-OCHF ₂	-
VIII-176	O	3-F, 4-OCHF ₂	-
VIII-177	O	4-F, 2-OCHF ₂	-
VIII-178	O	4-F, 3-CN	-
VIII-179	O	2-Cl, 4-Me	-
VIII-180	O	3-Cl, 4-Me	-
VIII-181	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	-
VIII-182	O	4-Me, 3-CF ₃	-
VIII-183	O	4-Me, 2-OMe	-
VIII-184	O	3-Me, 4-CN	-
VIII-186	O	4-Me, 3-CN	-
VIII-186	O	2,3,4-F ₉	-
VIII-187	O	2,3,5-F ₉	-
VIII-188	O	2,4,5-F ₉	-
VIII-189	O	3,4,6-F ₃	-
VIII-190	O	2,3-F ₂ , 4-Me	-
VIII-191	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	-
VIII-192	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-
VIII-193	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	-
VIII-194*	O	-	7-Cl
VIII-195*	O	-	6-Me
VIII-196*	O	-	7-Me

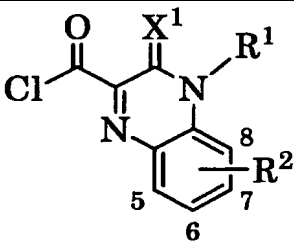
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-197*	O	-	8-Me
VIII-198	O	3-Me	8-Me
VIII-199	O	3-CF ₃	8 Me
VIII-200	O	4-OMe	8-Me
VIII-201	O	3-F, 4-Me	8-Me
VIII-202	O	3-F, 4-OMe	8-Me
VIII-203*	O	-	8-OMe
VIII-204	O	3-CF ₃	8-OMe
VIII-205	O	3-F, 4-Me	8-Cl
VIII-206	O	3-F, 4-Me	6-F
VIII-207	O	3-F, 4-Me	6-Cl
VIII-208	O	3-F, 4-Me	7-Me
VIII-209	O	3-F, 4-Me	6-Me
VIII-210*	O	-	8-Cl
VIII-211	O	3-F, 4-Me	6-OMe
VIII-212	O	3-OEt	-
VIII-213	O	4-OEt	-
VIII-214	O	4-OMe	8-Cl
VIII-215*	O	-	6-SMe
VIII-216	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe
VIII-217	O	3-F, 4-OEt	-
VIII-218	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl

Ejemplos específicos preferidos del compuesto representado por medio de la fórmula [J1] y la fórmula [J2] que son intermedios de producción de la presente invención se muestran en las siguientes Tablas 8 2 a 123. No obstante, no se pretende que los compuestos estén limitados a estos compuestos como en el caso del compuesto de la presente invención.

5

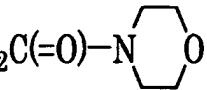
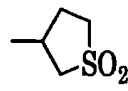
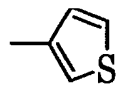
[Tabla 82]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-1	O	Me	-
IX-2	O	Et	-
IX-3	O	n-Pr	-
IX-4	O	i-Pr	-
IX-5	O	c-Pr	-
IX-6	O	n-Bu	-
IX-7	O	t-Bu	-
IX-8	O	c-Pen	-
IX-9	O	n-Hex	-
IX-10	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
IX-11	O	CH ₂ C≡CH	-
IX-12	O	CH ₂ CF ₃	-
IX-13	O	CH ₂ OMe	-
IX-14	O	CH ₂ OEt	-
IX-15	O	CH ₂ OPh	-
IX-16	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	-
IX-17	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
IX-18	O	CH ₂ OCH ₂ - 	-
IX-19	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
IX-20	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	-
IX-21	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	-
IX-22	O	CH ₂ SMe	-
IX-23	O	CH ₂ SEt	-
IX-24	O	CH ₂ SO ₂ Me	-
IX-25	O	CH ₂ SO ₂ Et	-
IX-26	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-
IX-27	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-

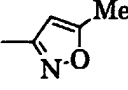
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-28	O	CH ₂ CH ₂ SMe	-
IX-29	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
IX-30	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-

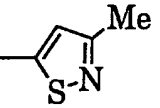
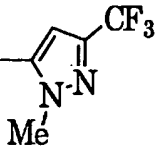
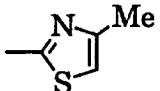
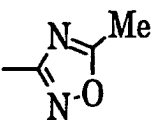
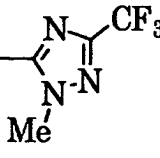
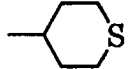
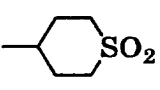
[Tabla 83]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-31	O	CH ₂ C(=O)Me	-
IX-32	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	-
IX-33	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	-
IX-34	O	CH ₂ C(=O)-N 	-
IX-35	O	CH ₂ CN	-
IX-36	O	CH ₂ CH ₂ CN	-
IX-37	O	Bn	-
IX-38	O	(2-Cl)Bn	-
IX-39	O	(3-Cl)Bn	-
IX-40	O	(4-Cl)Bn	-
IX-41	O	(2-OMe)Bn	-
IX-42	O	(3-OMe)Bn	-
IX-43	O	(4-OMe)Bn	-
IX-44	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	-
IX-45	O		-
IX-46	O		-
IX-47	O		-
IX-48	O		-

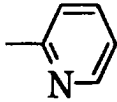
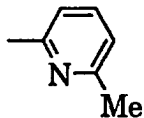
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-49	O		-
IX-50	O		-

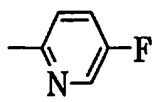
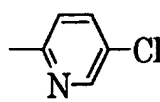
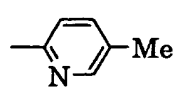
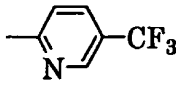
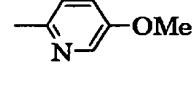
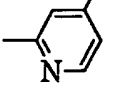
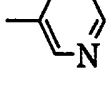
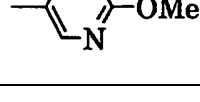
[Tabla 84]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-51	O		-
IX-52	O		-
IX-53	O		-
IX-54	O		-
IX-55	O		-
IX-56	O		-
IX-57	O		-
IX-58	O		-

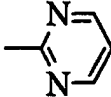
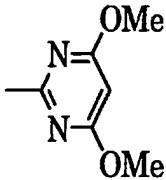
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-59	O		-
IX-60	O		-

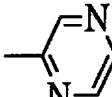
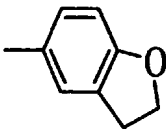
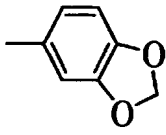
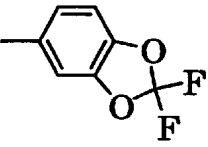
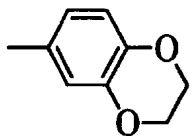
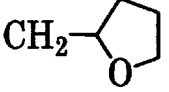
[Tabla 85]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-61	O		-
IX-62	O		-
IX-63	O		-
IX-64	O		-
IX-65	O		-
IX-66	O		-
IX-67	O		-
IX-68	O		-

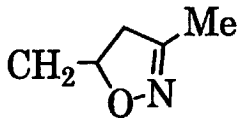
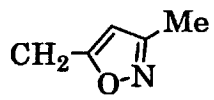
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-69	O		-
IX-70	O		-

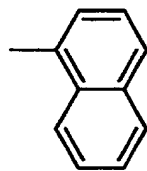
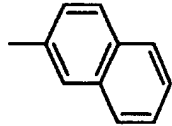
[Tabla 86]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-71	O		-
IX-72	O		-
IX-73	O		-
IX-74	O		-
IX-75	O		-
IX-76	O		-

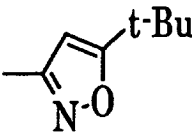
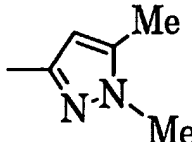
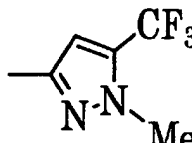
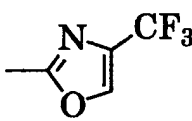
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-77	O		-
IX-78	O		-
IX-79	O	NHMe	-
IX-80	O	Me	6-F
IX-81	O	Me	7-F
IX-82	O	Me	5-Cl
IX-83	O	Me	6-Cl
IX-84	O	Me	7-Cl
IX-85	O	Me	8-Cl

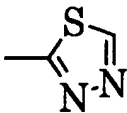
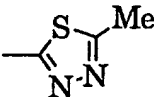
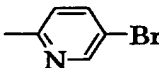
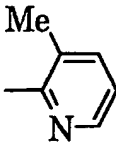
[Tabla 87]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-86	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl
IX-87	O	Me	7-OMe
IX-88	O	Me	5-SMe
IX-89	O	Me	7-SMe
IX-90	O	Me	5-SO ₂ Me
IX-91	O	Me	7-SO ₂ Me
IX-92	O	Me	6-NO ₂
IX-93	O	Me	7-NO ₂
IX-94	S	Me	-
IX-95	O		-
IX-96	O		-

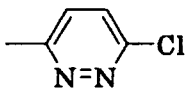
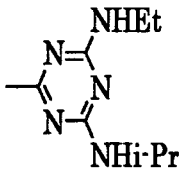
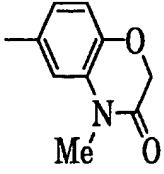
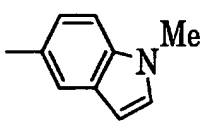
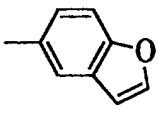
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-97	O		-
IX-98	O		-
IX-99	O		-
IX-100	O		-

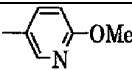
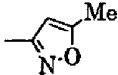
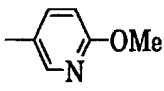
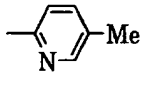
[Tabla 88]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-101	O		-
IX-102	O		-
IX-103	O		-
IX-104	O		-

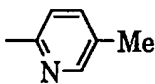
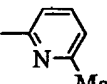
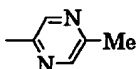
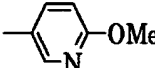
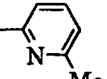
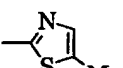
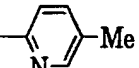
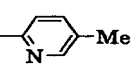
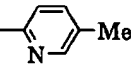
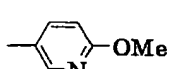
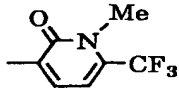
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-105	O		-
IX-106	O		-
IX-107	O		-
IX-108	O		-
IX-109	O		-
IX-110	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	-

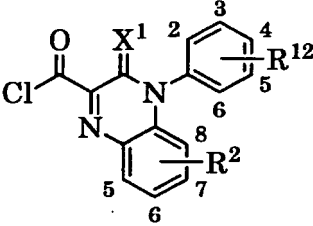
[Tabla 89]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-111	O		5-F
IX-113	O		6-F
IX-114	O	Me	5-CH ₂ OMe
IX-115	O		5, 7-F ₂
IX-116	O		7-Cl
IX-117	O	Et	5-Cl

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
IX-118	O	n-Bu	5-Cl
IX-119	O		7-Me
IX-120	O		6-CF ₃
IX-121	O		-
IX-122	O		5-Cl
IX-123	O		6-F
IX-124	O		-
IX-125	O		5-F
IX-126	O		6-Cl
IX-127	O		5-Me
IX-128	O		5-Me
IX-129	O		-

[Tabla 90]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-1	O	-	-
X-2	O	2-F	-
X-3	O	3-F	-
X-4	O	4-F	-
X-5	O	2-Cl	-
X-6	O	3-Cl	-
X-7	O	4-Cl	-
X-8	O	3-Me	-
X-9	O	4-Me	-
X-10	O	3-Et	-
X-11	O	4-Et	-
X-12	O	3-i-Pr	-
X-13	O	4-c-Pr	-
X-14	O	3-CF ₃	-
X-15	O	4-CF ₃	-
X-16	O	4-OH	-
X-17	O	2-OMe	-
X-18	O	3-OMe	-
X-19	O	4-OMe	-
X-20	O	3-OEt	-
X-21	O	4-OEt	-
X-22	O	3-O-n-Pr	-
X-23	O	3-O-i-Pr	-
X-24	O	4-O-i-Pr	-
X-25	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	-
X-26	O	4-OCH ₂ C≡CH	-

[Tabla 91]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-27	O	3-OCHF ₂	-
X-28	O	4-OCHF ₂	-
X-29	O	3-OCF ₃	-
X-30	O	4-OCH ₂ - 	-
X-31	O	3-SMe	-
X-32	O	4-SMe	-
X-33	O	3-SO ₂ Me	-
X-34	O	4-SO ₂ Me	-
X-35	O	2-NO ₂	-
X-36	O	3-NO ₂	-
X-37	O	4-NO ₂	-
X-38	O	3-CN	-
X-39	O	4-CN	-
X-40	O	4-C(=O)Me	-
X-41	O	4-C(=O)OMe	-
X-42	O	4-CH ₂ OMe	-
X-43	O	3-OMe, 4-Cl	-
X-44	O	3-OMe, 4-Me	-
X-45	O	3,4-(OMe) ₂	-
X-46	O	3,5-(OMe) ₂	-
X-47	O	2-F, 4-OMe	-
X-48	O	2-Cl, 4-OMe	-
X-49	O	2, 4-(OMe) ₂	-
X-50	O	3-F, 4-OMe	-
X-51	O	3-Cl, 4-OMe	-
X-52	O	3-Me, 4-OMe	-
X-53	O	3,4,5-(OMe) ₃	-
X-54	O	4-OMe	5-F
X-55	O	4-OMe	6-F
X-56	O	4-OMe	7-F

[Tabla 92]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-57	O	4-OMe	8-F
X-58	O	-	5-Cl
X-59	O	-	8-Cl
X-60	O	4-OMe	5-Cl
X-61	O	4-OMe	6-Cl
X-62	O	4-OMe	7-Cl
X-63	O	4-OMe	8-Cl
X-64	O	4-OCH ₂ CN	-
X-65	O	4-OCH ₂ -c-Pr	-
X-66	O	4-OCH ₂ CF ₃	-
X-67	O	4-NMe ₂	-
X-68	O	3,4-Me ₂	-
X-69	O	2-F, 4-Me	-
X-70	O	3-F, 4-Me	-
X-71	O	3-Me, 4-F	-
X-72	O	2-Cl, 4-Me	-
X-73	O	3-Cl, 4-Me	-
X-74	O	3-OEt, 4-OMe	-
X-75	O	2, 3, 4-(OMe) ₃	-
X-76	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	-
X-77	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-
X-78	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	-
X-79	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-
X-80	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-
X-81	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	-
X-82	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F
X-83	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-
X-84	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	-
X-85	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	-

[Tabla 93]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-86	O	-	5-F
X-87	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-88	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F
X-89	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F
X-90	O	-	6-F
X-91	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F
X-92	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F
X-93	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F
X-94	O	-	7-F
X-95	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F
X-96	O	-	8-F
X-97	O	-	5-Me
X-98	O	4-OMe	5-Me
X-99	O	4-OMe	6-Me
X-100	O	4-OMe	7-Me
X-101	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me
X-102	O	-	6-CF ₃
X-103	O	-	6-OMe
X-104	O	4-OMe	6-OMe
X-105	O	-	7-OMe
X-106	O	4-OMe	7-OMe
X-107	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
X-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
X-109	O	-	8-OMe
X-110	O	4-OMe	8-OMe
X-111	O	4-OMe	5,6-F ₂
X-112	O	4-OMe	5,7-F ₂
X-113	O	-	6,7-F ₂

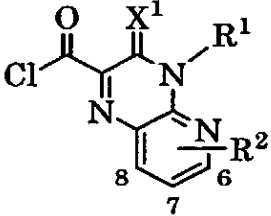
[Tabla 94]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-114	O	-	6,8-F ₂
X-115	O	4-OMe	5,7-Cl ₂
X-116	O	4-OMe	6-F, 7-OMe
X-117	O	3-F, 4-OMe	5-Cl

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
X-118	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe
X-119	O	-	7-CF ₃
X-120	O	4-F	7-OMe
X-121	O	4-OCHF ₂	7-OMe
X-122	O	4-Me	7-OMe

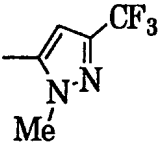
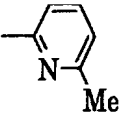
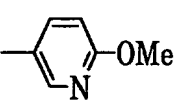
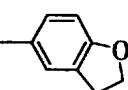
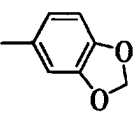
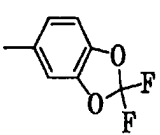
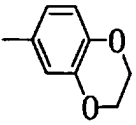
[Tabla 95]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XI-1	O	Me	-
XI-2	O	Et	-
XI-3	O	n-Pr	-
XI-4	O	n-Bu	-
XI-5	O	s-Bu	-
XI-6	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
XI-7	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
XI-8	O	CH ₂ C≡CH	-
XI-9	O	CH ₂ CF ₃	-
XI-10	O	CH ₂ CH ₂ F	-
XI-11	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
XI-12	O	CH ₂ SMe	-
XI-13	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-
XI-14	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-
XI-15	O	CH ₂ C(=O)OEt	-
XI-16	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	-
XI-17	O	Bn	-
XI-18	O	(2-F)Bn	-
XI-19	O	(2-Cl)Bn	-
XI-20	O	(2-CF ₃)Bn	-

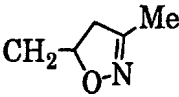
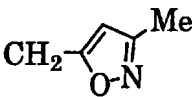
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XI-21	O	(3-CF ₃)Bn	-
XI-22	O	(2-OMe)Bn	-
XI-23	O	CH(Me)Ph	-
XI-24	O		-

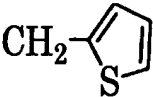
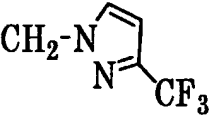
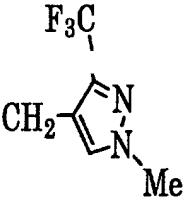
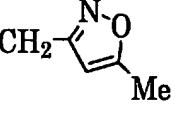
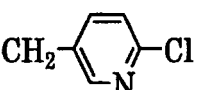
[Tabla 96]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XI-25	O		-
XI-26	O		-
XI-27	O		-
XI-28	O		-
XI-29	O		-
XI-30	O		-
XI-31	O		-
XI-32	O		-

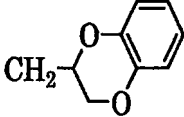
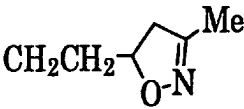
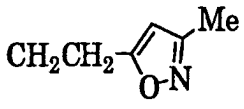
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XI-33	O		-
XI-34	O		-
XI-35	O	Me	6-Cl

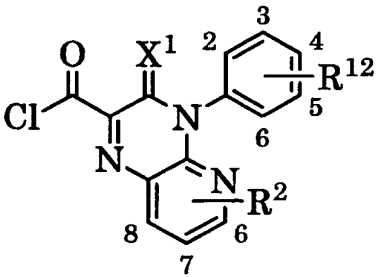
[Tabla 97]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XI-36	O	Me	6-OMe
XI-37	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	
XI-38	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	-
XI-39	O	CH ₂ CH ₂ ≡CH	-
XI-40	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	-
XI-41	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	-
XI-42	O	(2-OCHF ₂)Bn	-
XI-43	O	CH ₂ CH ₂ Ph	-
XI-44	O		-
XI-45	O		-
XI-46	O		-
XI-47	O		-
XI-48	O		-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XI-49	O		-
XI-50	O		-
XI-51	O		-
XI-52	O	Bn	8-Me
XI-53	O	Bn	7-Me
XI-54	O	Bn	6-Me
XI-55	O	Bn	6-OMe

[Tabla 98]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-1	O	-	-
XII-2	O	2-F	-
XII-3	O	3-F	-
XII-4	O	4-F	-
XII-5	O	2-Cl	-
XII-6	O	3-Cl	-
XII-7	O	4-Cl	-
XII-8	O	3-Br	-
XII-9	O	4-Br	-
XII-10	O	2-Me	-
XII-11	O	3-Me	-
XII-12	O	4-Me	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-13	O	3-Et	-
XII-14	O	4-Et	-
XII-15	O	4-i-Pr	-
XII-16	O	4-c-Pr	-
XII-17	O	2-CF ₃	-
XII-18	O	3-CF ₃	-
XII-19	O	4-CF ₃	-
XII-20	O	2-OMe	-
XII-21	O	3-OMe	-
XII-22	O	4-OMe	-
XII-23	O	2-OCHF ₂	-
XII-24	O	3-OCHF ₂	-
XII-25	O	4-OCHF ₂	-

[Tabla 99]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-26	O	2-OCF ₃	-
XII-27	O	3-OCF ₃	-
XII-28	O	4-OCF ₃	-
XII-29	O	4-SCF ₃	-
XII-30	O	3-CN	-
XII-31	O	2,3-F ₂	-
XII-32	O	2,4-F ₂	-
XII-33	O	2,5-F ₂	-
XII-34	O	2,6-F ₂	-
XII-35	O	3,4-F ₂	-
XII-36	O	3,5-F ₂	-
XII-37	O	2,3-Cl ₂	-
XII-38	O	2,4-Cl ₂	-
XII-39	O	2,5-Cl ₂	-
XII-40	O	2,6-Cl ₂	-
XII-41	O	3,4-Cl ₂	-
XII-42	O	3,5-Cl ₂	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-43	O	2,3-(OMe) ₂	-
XII-44	O	3-OMe, 4-F	-
XII-45	O	3-OMe, 4-Me	-
XII-46	O	3,4-(OMe) ₂	-
XII-47	O	3-OMe, 5-F	-
XII-48	O	3,5-(OMe) ₂	-
XII-49	O	2-F, 4-OMe	-
XII-50	O	2,4-(OMe) ₂	-
XII-51	O	3-F, 4-OMe	-
XII-52	O	3-Cl, 4-OMe	-
XII-53	O	3-Me, 4-OMe	-
XII-54	O	2,5-(OMe) ₂	-
XII-55	O	3,4,5-(OMe) ₃	-

[Tabla 100]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-56	O	-	6-F
XII-57	O	4-OMe	6-F
XII-58	O	-	6-Cl
XII-59	O	4-OMe	6-Cl
XII-60	O	4-OMe	6-OMe
XII-61	O	2-F,5-CF ₃	-
XII-62	O	3-CF ₃ ,4-F	-
XII-63	O	2-F,3-CF ₃	-
XII-64	O	3-F,5-CF ₃	-
XII-65	O	2,5-(Me) ₂	-
XII-66	O	3,4-(Me) ₂	-
XII-67	O	3,5-(Me) ₂	-
XII-68	O	3,5-(CF ₃) ₂	-
XII-69	O	2,6-(OMe) ₂	-
XII-70	O	2-F, 3-Cl	-
XII-71	O	2-F, 4-Cl	-
XII-72	O	2-F, 5-Cl	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-73	O	3-F, 4-Cl	-
XII-74	O	4-F, 2-Cl	-
XII-75	O	4-F, 3-Cl	-
XII-76	O	2-F, 3-Me	-
XII-77	O	2-F, 4-Me	-
XII-78	O	2-F, 5-Me	-
XII-79	O	3-F, 2-Me	-
XII-80	O	3-F, 4-Me	-

[Tabla 101]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-81	O	3-F, 5-Me	-
XII-82	O	4-F, 2-Me	-
XII-83	O	4-F, 3-Me	-
XII-84	O	5-F, 2-Me	-
XII-85	O	2-F, 4-CFg	-
XII-86	O	3-F, 4-CFg	-
XII-87	O	4-F, 2-CF ₃	-
XII-88	O	3-F, 2-OMe	-
XII-89	O	4-F, 2-OMe	-
XII-90	O	5-F, 2-OMe	-
XII-91	O	2-F, 4-OCHF ₂	-
XII-92	O	3-F, 4-OCHF ₂	-
XII-93	O	4-F, 2-OCHF ₂	-
XII-94	O	4-F, 3-CN	-
XII-95	O	2-Cl, 4-Me	-
XII-96	O	3-Cl, 4-Me	-
XII-97	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	-
XII-98	O	4-Me, 3-CF ₃	-
XII-99	O	4-Me, 2-OMe	-
XII-100	O	3-Me, 4-CN	-
XII-101	O	4-Me, 3-CN	-
XII-102	O	2,3,4-F ₃	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-103	O	2,3,5-F ₃	-
XII-104	O	2,4,5-F ₃	-
XII-105	O	3,4,5-F ₃	-
XII-106	O	2,3-F ₂ , 4-Me	-
XII-107	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	-

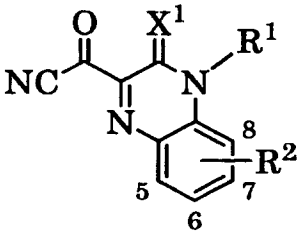
[Tabla 102]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-
XII-109	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	-
XII-110	O	-	7-Cl
XII-111	O	-	6-Me
XII-112	O	-	7-Me
XII-113	O	-	8-Me
XII-114	O	3-Me	8-Me
XII-115	O	3-CF ₃	8-Me
XII-116	O	4-OMe	8-Me
XII-117	O	3-F, 4-Me	8-Me
XII-118	O	3-F, 4-OMe	8-Me
XII-119	O	-	8-OMe
XII-120	O	3-CF ₃	8-OMe
XII-121	O	3-F, 4-Me	8-Cl
XII-122	O	3-F, 4-Me	6-F
XII-123	O	3-F, 4-Me	6-Cl
XII-124	O	3-F, 4-Me	7-Me
XII-125	O	3-F, 4-Me	6-Me
XII-126	O	-	8-Cl
XII-127	O	3-F, 4-Me	6-OMe
XII-128	O	3-OEt	-
XII-129	O	4-OEt	-
XII-130	O	4-OMe	8-Cl
XII-131	O	-	6-SMe
XII-132	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XII-133	O	3-F, 4-OEt	-
XII-134	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl

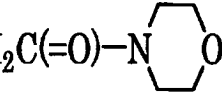
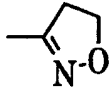
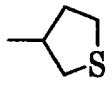
[Tabla 103]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-1	O	Me	-
XIII-2	O	Et	-
XIII-3	O	n-Pr	-
XIII-4	O	i-Pr	-
XIII-5	O	c-Pr	-
XIII-6	O	n-Bu	-
XIII-7	O	t-Bu	-
XIII-8	O	c-Pen	-
XIII-9	O	n-Hex	-
XIII-10	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
XIII-11	O	CH ₂ C≡CH	-
XIII-12	O	CH ₂ CF ₃	-
XIII-13	O	CH ₂ OMe	-
XIII-14	O	CH ₂ OEt	-
XIII-15	O	CH ₂ OPh	-
XIII-16	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	-
XIII-17	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
XIII-18	O	CH ₂ OCH ₂ - 	-
XIII-19	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
XIII-20	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	-
XIII-21	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	-
XIII-22	O	CH ₂ SMe	-

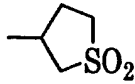
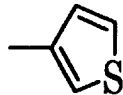
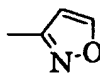
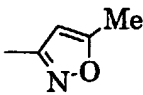
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-23	O	CH ₂ SEt	-
XIII-24	O	CH ₂ SO ₂ Me	-
XIII-25	O	CH ₂ SO ₂ Et	-
XIII-26	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-
XIII-27	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-
XIII-28	O	CH ₂ CH ₂ SMe	-
XIII-29	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-
XIII-30	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-

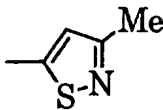
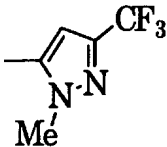
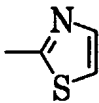
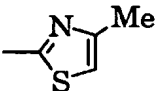
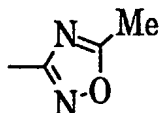
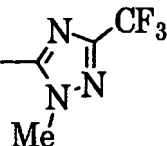
[Tabla 104]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-31	O	CH ₂ C(=O)Me	-
XIII-32	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	-
XIII-33	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	-
XIII-34	O	CH ₂ C(=O)-N 	-
XIII-35	O	CH ₂ CN	-
XIII-36	O	CH ₂ CH ₂ CN	-
XIII-37	O	Bn	-
XIII-38	O	(2-Cl)Bn	-
XIII-39	O	(3-Cl)Bn	-
XIII-40	O	(4-Cl)Bn	-
XIII-41	O	(2-OMe)Bn	-
XIII-42	O	(3-OMe)Bn	-
XIII-43	O	(4-OMe)Bn	-
XIII-44	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	-
XIII-45	O		-
XIII-46	O		-

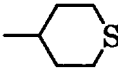
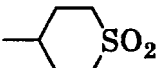
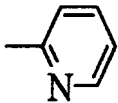
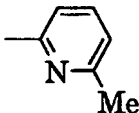
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-47	O		-
XIII-48	O		-
XIII-49	O		-
XIII-50	O		-

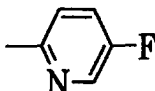
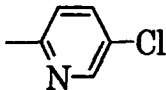
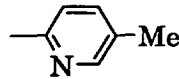
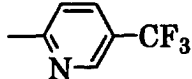
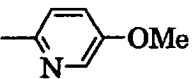
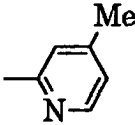
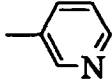
[Tabla 105]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-51	O		-
XIII-52	O		-
XIII-53	O		-
XIII-54	O		-
XIII-55	O		-
XIII-56	O		-

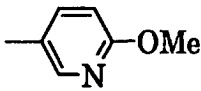
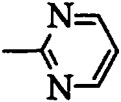
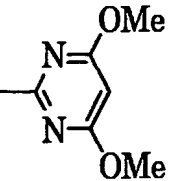
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-57	O		-
XIII-58	O		-
XIII-59	O		-
XIII-60	O		-

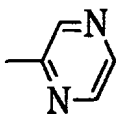
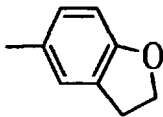
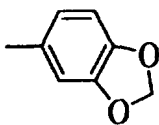
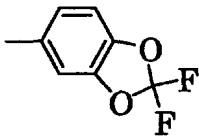
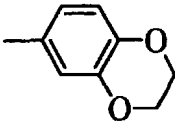
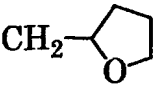
[Tabla 106]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-61	O		-
XIII-62	O		-
XIII-63	O		-
XIII-64	O		-
XIII-65	O		-
XIII-66	O		-
XIII-67	O		-

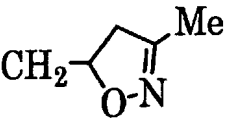
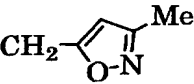
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-68	O		-
XIII-69	O		-
XIII-70	O		-

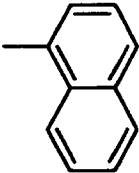
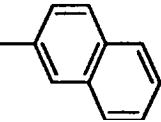
[Tabla 107]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-71	O		-
XIII-72	O		-
XIII-73	O		-
XIII-74	O		-
XIII-75	O		-
XIII-76	O		-

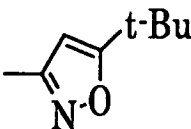
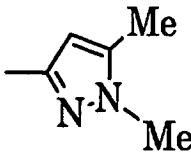
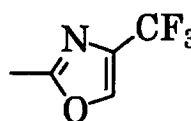
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-77	O		-
XIII-78	O		-
XIII-79	O	NHMe	-
XIII-80	O	Me	6-F
XIII-81	O	Me	7-F
XIII-82	O	Me	5-Cl
XIII-83	O	Me	6-Cl
XIII-84	O	Me	7-Cl
XIII-85	O	Me	8-Cl

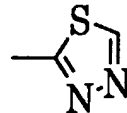
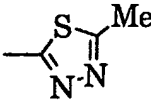
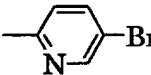
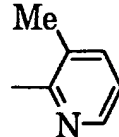
[Tabla 108]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-86	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl
XIII-87	O	Me	7-OMe
XIII-88	O	Me	5-SMe
XIII-89	O	Me	7-SMe
XIII-90	O	Me	5-SO ₂ Me
XIII-91	O	Me	7-SO ₂ Me
XIII-92	O	Me	6-NO ₂
XIII-93	O	Me	7-NO ₂
XIII-94	S	Me	-
XIII-95	O		-
XIII-96	O		-

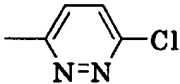
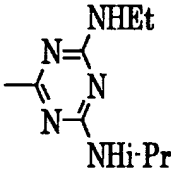
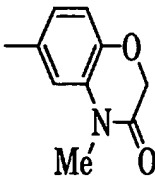
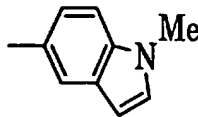
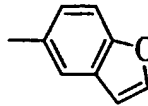
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-97	O		-
XIII-98	O		-
XIII-99	O		-
XIII-100	O		-

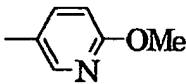
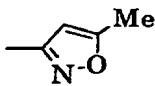
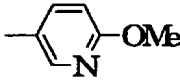
[Tabla 109]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-101	O		-
XIII-102	O		-
XIII-103	O		-
XIII-104	O		-

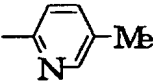
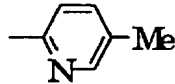
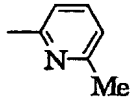
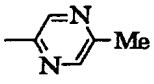
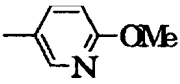
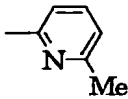
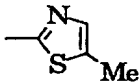
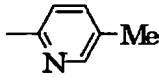
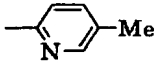
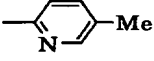
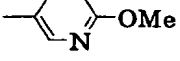
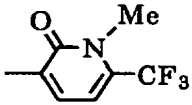
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-105	O		-
XIII-106	O		-
XIII-107	O		-
XIII-108	O		-
XIII-109	O		-
XIII-110	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	-

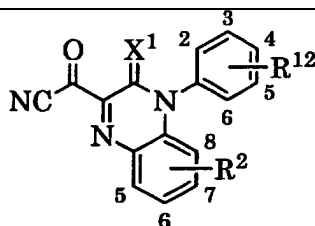
[Tabla 110]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-111	O		5-F
XIII-112	O	Bn	6-F
XIII-113	O		6-F
XIII-114	O	Me	5-CH ₂ OMe
XIII-115	O		5,7-F ₂

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XIII-116	O		7-Cl
XIII-117	O	Et	5-Cl
XIII-118	O	n-Bu	5-Cl
XIII-119	O		7-Me
XIII-120	O		6-CF ₃
XIII-121	O		-
XIII-122	O		5-Cl
XIII-123	O		6-F
XIII-124	O		-
XIII-126	O		5-F
XIII-126	O		5-Cl
XIII-127	O		5-Me
XIII-128	O		5-Me
XIII-129	O		-

[Tabla 111]



Compuesto N°	X ¹		R ²
XIV-1	O	-	-
XIV-2	O	2-F	-
XIV-3	O	3-F	-
XIV-4	O	4-F	-
XIV-5	O	2-Cl	-
XIV-6	O	3-Cl	-
XIV-7	O	4-Cl	-
XIV-8	O	3-Me	-
XIV-9	O	4-Me	-
XIV-10	O	3-Et	-
XIV-11	O	4-Et	-
XIV-12	O	3-i-Pr	-
XIV-13	O	4-c-Pr	-
XIV-14	O	3-CF ₃	-
XIV-15	O	4-CF ₃	-
XIV-16	O	4-OH	-
XIV-17	O	2-OMe	-
XIV-18	O	3-OMe	-
XIV-19	O	4-OMe	-
XIV-20	O	3-OEt	-
XIV-21	O	4-OEt	-
XIV-22	O	3-O-n-Pr	-
XIV-23	O	3-O-i-Pr	-
XIV-24	O	4-O-i-Pr	-
XIV-25	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	-
XIV-26	O	4-OCH ₂ C≡CH	-

[Tabla 112]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-27	O	3-OCHF ₂	-
XIV-28	O	4-OCHF ₂	-
XIV-29	O	3-OCF ₃	-
XIV-30	O	4-OCH ₂ 	-
XIV-31	O	3-SMe	-
XIV-32	O	4-SMe	-
XIV-33	O	3-SO ₂ Me	-
XIV-34	O	4-SO ₂ Me	-
XIV-35	O	2-NO ₂	-
XIV-36	O	3-NO ₂	-
XIV-37	O	4-NO ₂	-
XIV-38	O	3-CN	-
XIV-39	O	4-CN	-
XIV-40	O	4-C(=O)Me	-
XIV-41	O	4-C(=O)OMe	-
XIV-42	O	4-CH ₂ OMe	-
XIV-43	O	3-OMe, 4-Cl	-
XIV-44	O	3-OMe, 4-Me	-
XIV-45	O	3,4-(OMe) ₂	-
XIV-46	O	3,5-(OMe) ₂	-
XIV-47	O	2-F, 4-OMe	-
XIV-48	O	2-Cl, 4-OMe	-
XIV-49	O	2,4-(OMe) ₂	-
XIV-50	O	3-F, 4-OMe	-
XIV-51	O	3-Cl, 4-OMe	-
XIV-52	O	3-Me, 4-OMe	-
XIV-53	O	3,4,5-(OMe) ₃	-
XIV-54	O	4-OMe	5-F
XIV-55	O	4-OMe	6-F
XIV-56	O	4-OMe	7-F

[Tabla 113]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-57	O	4-OMe	8-F
XIV-58	O	-	5-Cl
XIV-59	O	-	8-Cl
XIV-60	O	4-OMe	5-Cl
XIV-61	O	4-OMe	6-Cl
XIV-62	O	4-OMe	7-Cl
XIV-63	O	4-OMe	8-Cl
XIV-64	O	4-OCH ₂ CN	-
XIV-65	O	4-OCH ₂ -c-Pr	-
XIV-66	O	4-OCH ₂ CF ₃	-
XIV-67	O	4-NMe ₂	-
XIV-68	O	3,4-Me ₂	-
XIV-69	O	2-F, 4-Me	-
XIV-70	O	3-F, 4-Me	-
XIV-71	O	3-Me, 4-F	-
XIV-72	O	2-Cl, 4-Me	-
XIV-73	O	3-Cl, 4-Me	-
XIV-74	O	3-OEt, 4-OMe	-
XIV-75	O	2,3,4-(OMe) ₃	-
XIV-76	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	-
XIV-77	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	-
XIV-78	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	-
XIV-79	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-
XIV-80	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	-
XIV-81	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	-
XIV-82	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F
XIV-83	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	-
XIV-84	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	-
XIV-85	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	-

[Tabla 114]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-86	O	-	5-F
XIV-87	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F
XIV-88	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F
XIV-89	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F
XIV-90	O	-	6-F
XIV-91	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F
XIV-92	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F
XIV-93	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F
XIV-94	O	-	7-F
XIV-95	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F
XIV-96	O	-	8-F
XIV-97	O	-	5-Me
XIV-98	O	4-OMe	5-Me
XIV-99	O	4-OMe	6-Me
XIV-100	O	4-OMe	7-Me
XIV-101	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me
XIV-102	O	-	6-CF ₃
XIV-103	O	-	6-OMe
XIV-104	O	4-OMe	6-OMe
XIV-105	O	-	7-OMe
XIV-106	O	4-OMe	7-OMe
XIV-107	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
XIV-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
XIV-109	O	-	8-OMe
XIV-110	O	4-OMe	8-OMe
XIV-111	O	4-OMe	5,6-F ₂
XIV-112	O	4-OMe	5,7-F ₂
XIV-113	O	-	6,7-F ₂

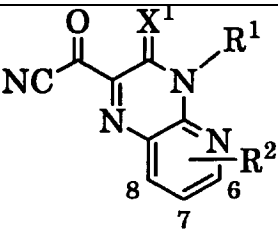
[Tabla 115]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-114	O	-	6,8-F ₂
XIV-115	O	4-OMe	5,7-Cl ₂
XIV-116	O	4-OMe	6-F, 7-OMe

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-117	O	3-F, 4-OMe	5-Cl
XIV-118	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe
XIV-119	O	-	7-CF ₃
XIV-120	O	4-F	7-OMe
XIV-121	O	4-OCHF ₂	7-OMe
XIV-122	O	4-Me	7-OMe
XIV-123	O	4-OMe	5-Br
XIV-124	O	4-F	5-F
XIV-125	O	3-F, 4-OEt	-

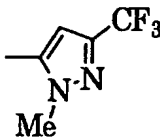
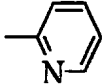
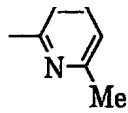
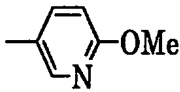
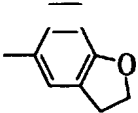
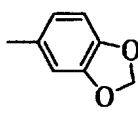
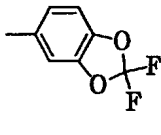
[Tabla 116]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XV-1	O	Me	-
XV-2	O	Et	-
XV-3	O	n-Pr	-
XV-4	O	i-Pr	-
XV-5	O	n-Bu	-
XV-6	O	s-Bu	-
XV-7	O	CH ₂ CH=CH ₂	-
XV-8	O	CH ₂ C≡CH	-
XV-9	O	CH ₂ CF ₃	-
XV-10	O	CH ₂ CH ₂ ^F	-
XV-11	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	-
XV-12	O	CH ₂ SMe	-
XV-13	O	CH ₂ CH ₂ OMe	-
XV-14	O	CH(Me)CH ₂ OMe	-
XV-15	O	CH ₂ C(=O)OEt	-
XV-16	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	-

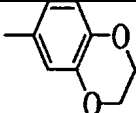
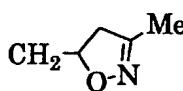
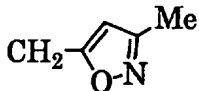
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XV-17	O	Bn	-
XV-18	O	(2-F)Bn	-
XV-19	O	(2-Cl)Bn	-
XV-20	O	(2-CF ₃)Bn	-
XV-21	O	(3-CF ₃)Bn	-
XV-22	O	(2-OMe)Bn	-
XV-23	O	CH(Me)Ph	-
XV-24	O		-

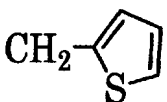
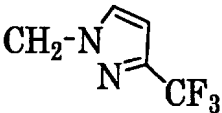
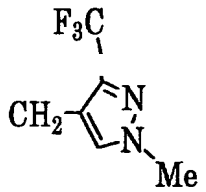
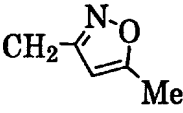
[Tabla 117]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XV-25	O		-
XV-26	O		-
XV-27	O		-
XV-28	O		-
XV-29	O		-
XV-30	O		-
XV-31	O		-

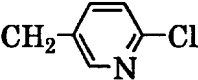
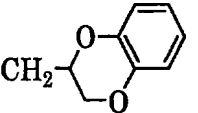
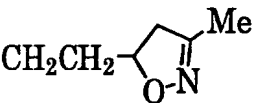
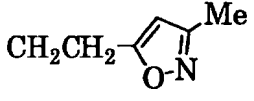
(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XV-32	O		-
XV-33	O		-
XV-34	O		-
XV-35	O	Me	6-Cl

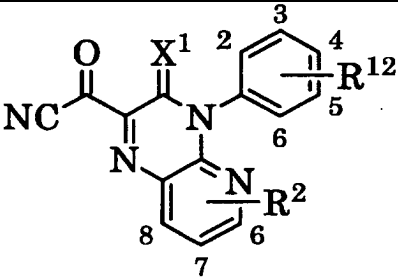
[Tabla 118]

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XV-36	O	Me	6-OMe
XV-37	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-
XV-38	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	-
XV-39	O	CH ₂ CH ₂ C≡CH	-
XV-40	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	-
XV-41	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	-
XV-42	O	(2-OCHF ₂)Bn	-
XV-43	O	CH ₂ CH ₂ Ph	-
XV-44	O		-
XV-45	O		-
XV-46	O		-
XV-47	O		-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹	R ²
XV-48	O		-
XV-49	O		-
XV-50	O		-
XV-51	O		-
XV-52	O	Bn	8-Me
XV-53	O	Bn	7-Me
XV-54	O	Bn	6-Me
XV-55	O	Bn	6-OMe

[Tabla 119]

			
Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-1	O	-	-
XVI-2	O	2-F	-
XVI-3	O	3-F	-
XVI-4	O	4-F	-
XVI-5	O	2-Cl	-
XVI-6	O	3-Cl	-
XVI-7	O	4-Cl	-
XVI-8	O	3-Br	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-9	O	4-Br	-
XVI-10	O	2-Me	-
XVI-11	O	3-Me	-
XVI-12	O	4-Me	-
XVI-13	O	3-Et	-
XVI-14	O	4-Et	-
XVI-15	O	4-i-Pr	-
XVI-16	O	4-c-Pr	-
XVI-17	O	2-CF ₃	-
XVI-18	O	3-CF ₃	-
XVI-19	O	4-CF ₃	-
XVI-20	O	2-OMe	-
XVI-21	O	3-OMe	-
XVI-22	O	4-OMe	-
XVI-23	O	2-OCHF ₂	-
XVI-24	O	3-OCHF ₂	-
XVI-25	O	4-OCHF ₂	-

[Tabla 120]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-26	O	2-OCF ₃	-
XVI-27	O	3-OCF ₃	-
XVI-28	O	4-OCF ₃	-
XVI-29	O	4-SCF ₃	-
XVI-30	O	3-CN	-
XVI-31	O	2,3-F ₂	-
XVI-32	O	2,4-F ₂	-
XVI-33	O	2,5-F ₂	-
XVI-34	O	2,6-F ₂	-
XVI-35	O	3,4-F ₂	-
XVI-36	O	3,5-F ₂	-
XVI-37	O	2,3-Cl ₂	-
XVI-38	O	2,4-Cl ₂	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-39	O	2,5-Cl ₂	-
XVI-40	O	2,6-Cl ₂	-
XVI-41	O	3,4-C ₁ 2	-
XVI-42	O	3,5-Cl ₂	-
XVI-43	O	2,3-(OMe) ₂	-
XVI-44	O	3-OMe, 4-F	-
XVI-45	O	3-OMe,4-Me	-
XVI-46	O	3,4-(OMe) ₂	-
XVI-47	O	3-OMe, 5-F	-
XVI-48	O	3,5-(OMe) ₂	-
XVI-49	O	2-F, 4-OMe	-
XVI-50	O	2,4-(OMe) ₂	-
XVI-51	O	3-F, 4-OMe	-
XVI-52	O	3-Cl, 4-OMe	-
XVI-53	O	3-Me, 4-OMe	-
XVI-54	O	2,5-(OMe) ₂	-
XVI-55	O	3,4,5-(ona) ₃	-

[Tabla 121]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-56	O	-	6-F
XVI-57	O	4-OMe	6-F
XVI-58	O	-	6-Cl
XVI-59	O	4-OMe	6-Cl
XVI-60	O	4-OMe	6-OMe
XVI-61	O	2-F,5-CF ₃	-
XVI-62	O	3-CF ₃ ,4-F	-
XVI-63	O	2-F,3-CF ₃	-
XVI-64	O	3-F,5-CF ₃	-
XVI-65	O	2,5-(Me) ₂	-
XVI-66	O	3,4-(Me) ₂	-
XVI-67	O	3,5-(Me) ₂	-
XVI-68	O	3,5-(CF ₃) ₂	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-69	O	2,6-(OMe) ₂	-
XVI-70	O	2-F, 3-Cl	-
XVI-71	O	2-F, 4-Cl	-
XVI-72	O	2-F, 5-Cl	-
XVI-73	O	3-F, 4-Cl	-
XVI-74	O	4-F, 2-Cl	-
XVI-75	O	4-F, 3-Cl	-
XVI-76	O	2-F, 3-Me	-
XVI-77	O	2-F, 4-Me	-
XVI-78	O	2-F, 5-Me	-
XVI-79	O	3-F, 2-Me	-
XVI-80	O	3-F, 4-Me	-

[Tabla 122]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-81	O	3-F, 5-Me	-
XVI-82	O	4-F, 2-Me	-
XVI-83	O	4-F, 3-Me	-
XVI-84	O	5-F, 2-Me	-
XVI-85	O	2-F, 4-CF ₃	-
XVI-86	O	3-F, 4-CFg	-
XVI-87	O	4-F, 2-CF ₃	-
XVI-88	O	3-F, 2-OMe	-
XVI-89	O	4-F, 2-OMe	-
XVI-90	O	5-F, 2-OMe	-
XVI-91	O	2-F, 4-OCHF ₂	-
XVI-92	O	3-F, 4-OCHF ₂	-
XVI-93	O	4-F, 2-OCHF ₂	-
XVI-94	O	4-F, 3-CN	-
XVI-95	O	2-Cl, 4-Me	-
XVI-96	O	3-Cl, 4-Me	-
XVI-97	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	-
XVI-98	O	4-Me, 3-CF ₃	-

(Continuación)

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-99	O	4-Me, 2-OMe	-
XVI-100	O	3-Me, 4-CN	-
XVI-101	O	4-Me, 3-CN	-
XVI-102	O	2,3,4-F ₃	-
XVI-103	O	2,3,5-F ₃	-
XVI-104	O	2,4,5-F ₃	-
XVI-105	O	3,4,5-F ₃ *	-
XVI-106	O	2,3-F ₂ , 4-Me	-
XVI-107	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	-

[Tabla 123]

Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-108	O	3,2-F ₂ , 4-OMe	-
XVI-109	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	-
XVI-110	O	-	7-Cl
XVI-111	O	-	6-Me
XVI-112	O	-	7-Me
XVI-113	O	-	8-Me
XVI-114	O	3-Me	8-Me
XVI-115	O	3-CF ₃	8-Me
XVI-116	O	4-OMe	8-Me
XVI-117	O	3-F, 4-Me	8-Me
XVI-118	O	3-F, 4-OMe	8-Me
XVI-119	O	-	8-OMe
XVI-120	O	3-CF ₃	8-OMe
XVI-121	O	3-F, 4-Me	8-Cl
XVI-122	O	3-F, 4-Me	6-F
XVI-123	O	3-F, 4-Me	6-Cl
XVI-124	O	3-F, 4-Me	7-Me
XVI-125	O	3-F, 4-Me	6-Me
XVI-126	O	-	8-Cl
XVI-127	O	3-F, 4-Me	6-OMe
XVI-128	O	3-OEt	-

(Continuación)

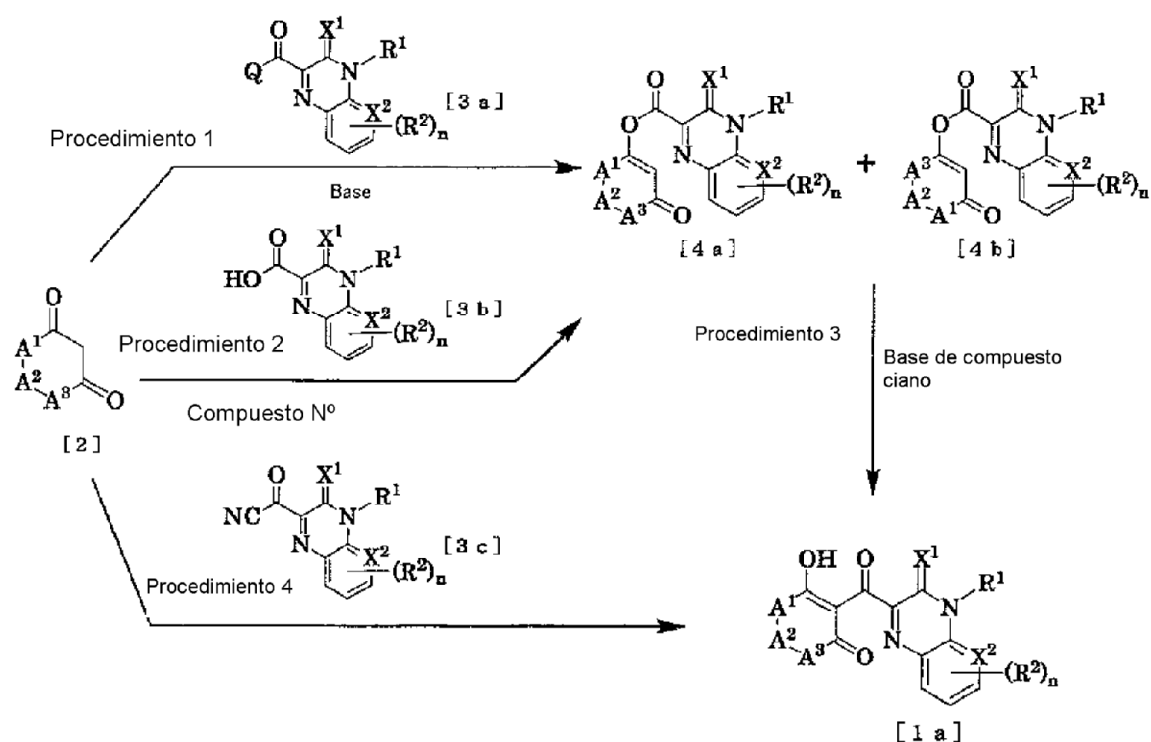
Compuesto N°	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-129	O	4-OEt	-
RVI-130	O	4-OMe	8-Cl
XVI-131	O	-	6-SMe
XVI-132	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe
XVI-133	O	3-F, 4-OEt	-
XVI-134	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl

Procedimientos representativos para producir el compuesto de la presente invención representado por medio de la fórmula [I] se ilustran a continuación, por el procedimiento no se encuentra limitado a los presentes procedimientos.

5 Procedimiento de Producción 1

Se puede producir el compuesto de la presente invención representado por medio de la siguiente fórmula [1a] por medio de procedimientos basados en el esquema de reacción como se ilustra a continuación.

[Fórmula Química 12]



en el que R¹, R², A¹, A², A³, n, X¹ y X² tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente; y Q representa un grupo saliente tal como halógeno, un grupo alquilcarboniloxi, un grupo analcoxycarboniloxi, un grupo haloalquilcarboniloxi, un grupo haloalcoxycarboniloxi, un grupo benciloxi, un grupo piridilo o un grupo imidazolilo.

Procedimiento 1

Se pueden producir los compuestos de éster de enol representados por medio de las formula [4a] y [4b] permitiendo un compuesto representado por medio de la fórmula [2] para reaccionar con un compuesto representado por medio

de la fórmula [3a] en un disolvente en presencia de una base. (En lo sucesivo, por ejemplo, "el compuesto representado por medio de la fórmula [2]" también puede describirse simplemente como "fórmula [2]"). La cantidad a usar de la fórmula [3a] según se usa en la presente memoria se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en 1 mol de la fórmula [2].

- 5 Como base que se puede usar en el presente procedimiento, por ejemplo, se pueden incluir, por ejemplo, aminas orgánicas tales como trietilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, N,N-dimetilanilina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno; sales de metal de ácido carboxílico representadas por medio de carbonatos de metal tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de magnesio y carbonato de calcio; hidrogeno carbonatos de metal tales como hidrogeno carbonato de sodio e hidrogeno carbonato de potasio; y acetatos de metal tales como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio y acetato de magnesio; alcóxidos de metal tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, butóxido terciario de sodio, metóxido de potasio y butóxido terciario de potasio; hidróxidos de metal tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio e hidróxido de magnesio; hidruros de metal tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; y similares. La cantidad de uso de la base se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol de la fórmula [2].

- El disolvente que se puede usar en el presente procedimiento puede ser cualquier disolvente con tal de que no inhiba el avance de la presente reacción, y por ejemplo, se pueden usar nitrilos tales como acetonitrilo; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, tetrahidrofurano, dioxano, monoglimal y diglimal; hidrocarburos halogenados tales como dicloroetano, cloroformo, tetracloro carbono y tetracloroetano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, clorobenceno, nitrobenzono y tolueno; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; imidazolinonas tales como 1,3-dimetil-2-imidazolinona; compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido; y similares. Además, también se pueden usar mezclas de disolventes.

La cantidad de uso del disolvente es de 0,01 a 100 ml, y preferentemente de 0,1 a 10 l, basándose en la fórmula [2].

- Se puede escoger la temperatura de reacción dentro del intervalo de -20 °C hasta la zona de punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0 °C a 100 °C.

Además, la reacción se puede llevar a cabo usando un catalizador de transferencia de fase tal como una sal de amonio cuaternario. En el caso de usar un catalizador de transferencia de fase, su cantidad es de 0,0001 a 1,0 moles, y preferentemente de 0,001 a 0,1 moles, basándose en un mol de la fórmula [2].

- El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, substrato de reacción, alcance de la reacción y similar, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

Los compuestos de fórmula [4a] y de fórmula [4b], que son los productos diana de la reacción, se pueden recoger a partir del sistema de reacción por medio de un procedimiento convencional tras completar la reacción, y se pueden purificar posteriormente por medio de operaciones tales como cromatografía en columna y recristalización, en caso de resultar necesario.

35 Procedimiento 2

También se pueden producir las fórmulas [4a] y [4b] permitiendo que la fórmula [2] y la fórmula [3b] reaccionen con un disolvente en presencia de un agente de condensación de deshidratación en presencia o en ausencia de una base.

- La cantidad de uso de la fórmula [3b] según se usa en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles, y preferentemente de 1 a 1,2 moles, basándose en un mol de la fórmula [2].

Como agente de condensación de deshidratación, se puede usar diciclohexilcarbodiimida (DCC), N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (EDC o WSC), N,N-carbonildiimidazol, cloruro de 2-cloro-1,3-dimetilimidazolio, yoduro de 2-cloro-1-piridinio y similares.

- Se pueden ejemplificar la base y el disolvente de reacción que se pueden usar en el presente procedimiento por medio de los descritos en el Procedimiento 1. La cantidad de base usada en la reacción del presente procedimiento es de 0 a 100 moles y preferentemente de 0 a 10 moles, basándose en un mol de fórmula [2].

- La cantidad de uso del disolvente es de 0,001 a 100 l y preferentemente de 0,1 a 10 l, basándose en un mol de fórmula [2]. Se puede escoger de forma apropiada la temperatura de reacción dentro del intervalo de -20 °C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0 °C a 100 °C.

El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, substrato de reacción, alcance de la reacción y similar, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

Procedimiento 3

Se puede producir la fórmula [1a] haciendo reaccionar [4a] y la fórmula [4b] producidos en el procedimiento 2 ó 3, con un compuesto ciano en presencia de una base.

La cantidad a usar en el presente procedimiento se puede ejemplificar por medio de las mismas bases descritas con respecto al procedimiento 1.

- 5 La cantidad a usar de la base se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol de la fórmula [4a] y de la fórmula [4b].

El compuesto ciano que se puede usar en el presente procedimiento se puede ejemplificar por medio de cianuro de potasio, cianuro de sodio, cianohidrina de acetona, ácido cianhídrico, un polímero que transporta ácido cianhídrico y similares.

- 10 La cantidad de uso del compuesto ciano se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 1,0 moles y preferentemente de 0,05 a 0,2 moles, basándose en un mol de las fórmula [4a] y [4b].

Además, en el presente procedimiento, también se puede usar un catalizador de transferencia de fase tal como un éter corona.

- 15 La cantidad de uso del catalizador de transferencia de fase es de 0,001 a 10 moles, y preferentemente de 0,01 a 10 moles, basándose en un mol de las fórmula [4a] y [4b].

El disolvente que se puede usar en la presente reacción se puede ejemplificar por medio de los mismos disolventes descritos con respecto al procedimiento 1, y su cantidad de uso es de 0,01 a 100 l, y preferentemente de 0,1 a 10 l, basándose en un mol de las fórmula [4a] y [4b].

- 20 La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -20 °C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0° C a 100 °C.

El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

De manera adicional, en el presente procedimiento, todavía se puede producir la fórmula [1a], incluso si las fórmulas [4a] y [4b] producidas en el procedimiento 1 o procedimiento 2 se usan sin aislamiento alguno.

- 25 Procedimiento 4

También se puede producir el compuesto de fórmula [1a] haciendo reaccionar la fórmula [2] con la fórmula [3c] en presencia de una base o ácido de Lewis. Además, se puede producir el intermedio de producción de la fórmula [3c] haciendo reaccionar un compuesto representado por medio de la fórmula [3a-1] con un agente de formación cianógeno. La cantidad de uso de la fórmula [3c] usada en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol de fórmula [2].

- 30

El ácido de Lewis que se puede usar incluye cloruro de cinc, cloruro de aluminio y similar.

En caso de usar un ácido de Lewis, se puede escoger de forma apropiada la cantidad de uso del ácido de Lewis dentro del intervalo de 0,01 a 100 moles, y preferentemente de 0,1 a 10 moles, basándose en un mol de fórmula [2].

- 35 La cantidad que se puede usar en el presente procedimiento se puede ejemplificar por medio de las mismas bases descritas con respecto al procedimiento 1.

En caso de usar una base, la cantidad de uso de la base se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol de la fórmula [2].

- 40 El disolvente que se puede usar en el presente procedimiento se puede ejemplificar por medio de los descritos con respecto al procedimiento 1, y su cantidad de uso es de 0,01 a 100 l, y preferentemente de 0,1 a 10 l, basándose en un mol de fórmula [2].

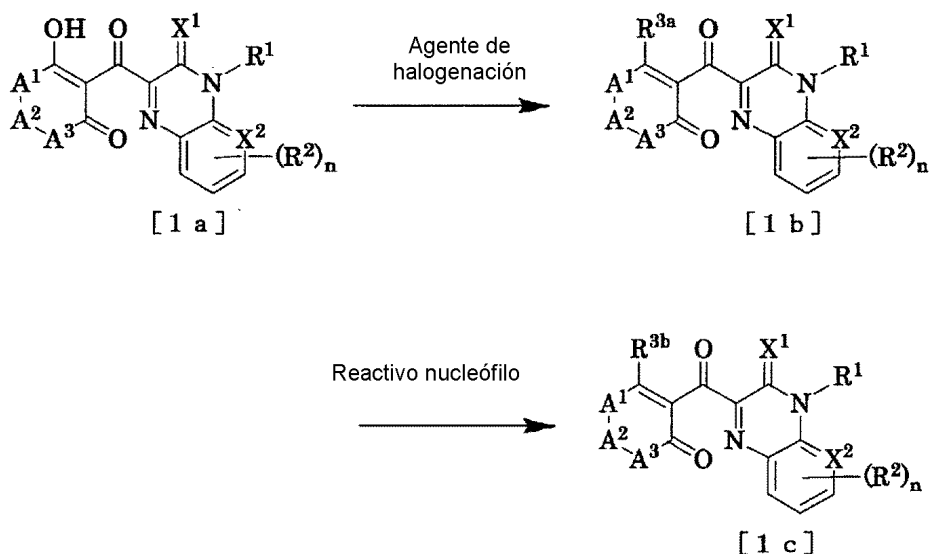
La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -20 °C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0° C a 100 °C.

- 45 El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

Procedimiento de producción 2

Además, se pueden producir los compuestos representados por medio de las fórmula [1b] y [1c] de la presente invención a partir del compuesto representado por medio de la fórmula [1a] de la presente invención, de acuerdo con el procedimiento de producción siguiente.

[Fórmula Química 13]



en el que X^1 , X^2 , R^1 , R^2 , A^1 , A^2 , A^3 y n tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente, R^{3a} representa un átomo de halógeno tal como cloro o bromo; y R^{3b} representa un grupo amino, un grupo alquiltio C_1 - C_6 , un grupo alquil C_1 - C_6 haloalquiltio C_1 - C_6 , un grupo alqueniltio C_1 - C_6 , un grupo alquiniltio C_1 - C_6 , un grupo alquilcarbonilo C_1 - C_6 , un grupo alquenilcarbonilo C_1 - C_6 , un grupo alquilcarbonilo C_1 - C_6 , un grupo fenilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes), un grupo feniltio (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes), un grupo fenilcarbonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes), un grupo 1,2,4-triazol, un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-2-ilo, un grupo imidazolil-1-ilo, un grupo pirazol-1-ilo, un grupo tetrazol-1-ilo o un grupo tetrazolil-1-ilo.

En otras palabras, se puede producir el compuesto de fórmula [1b] haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [1a] con un agente de halogenación, y se puede producir el compuesto de fórmula [1c] haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [1b] con un reactivo nucleófilo en presencia de una base.

El agente de halogenación que se puede usar en el procedimiento de conversión desde la fórmula [1a] hasta la fórmula [1b] incluso cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, oxiclорuro de fósforo, oxibromuro de fósforo, tribromuro de feniltrimetilamonio y un bromuro de ácidos de Meldrum y similares. La cantidad de uso del agente de halogenación se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol del compuesto de fórmula [1a].

Se puede ejemplificar el disolvente que se puede usar por medio de los mismos disolventes que se describen con respecto al procedimiento 1 del procedimiento de producción 1.

La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -20 °C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0° C a 100 °C. El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

Como reactivo nucleófilo que se puede usar en el procedimiento de conversión desde la fórmula [1b] hasta la fórmula [1c], se pueden incluir alcoholes tales como metanol, etanol y alcohol bencílico; mercaptanos tales como metil mercaptano y etil mercaptano; aminas tales como amoníaco, metilamina y etilamina; y similares. La cantidad de uso del reactivo nucleófilo se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,5 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol del compuesto de fórmula [1a].

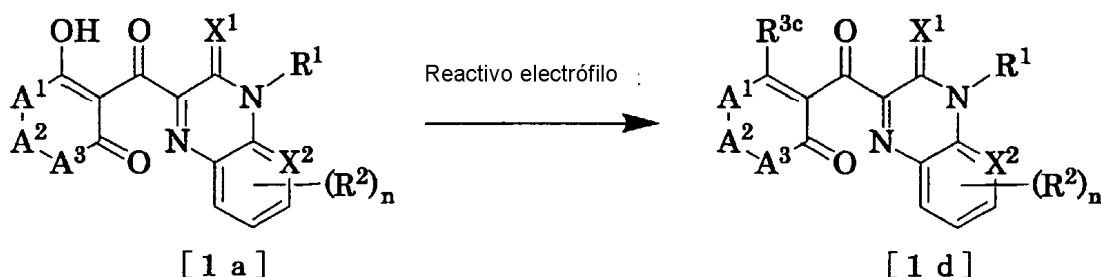
La base que se puede usar se puede ejemplificar por medio de las mismas bases que se han descrito con respecto al procedimiento 1 del procedimiento de producción 1, y el disolvente que se puede usar se puede ejemplificar por medio de los mismos disolventes que se describen con respecto al procedimiento 1 del procedimiento de producción 1.

La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -20 °C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0° C a 100 °C. El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

Procedimiento de producción 3

Se puede producir el compuesto de la presente invención representado por medio de la siguiente fórmula [1d] por medio de un procedimiento basado en el esquema de reacción como se ilustra a continuación.

[Fórmula Química 14]



en el que X^1 , X^2 , R^1 , R^2 , A^1 , A^2 , A^3 y n tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente, R^3 representa un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 , un grupo alquilcarbonilo C_1-C_6 , un grupo alquencarbonilo C_1-C_6 , un grupo alquilcarbonilo C_1-C_6 , un grupo fenilsulfonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes), un grupo fenilcarbonilo (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes).

En otras palabras, se puede producir el compuesto de fórmula [1d] haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [1a] con un agente de electrófilo en un disolvente en presencia/ausencia de una base.

Como agente electrófilo que se puede usar, se pueden incluir, por ejemplo, haluros tales como yodometano y bromuro de bencilo; cloruro de ácido tales como cloruro de acetilo y cloruro de benzoilo; cloruro de ácidos sulfónicos tales como cloruro de metanosulfonilo y cloruro de p-toluensulfonilo; ésteres de ácido sulfúrico como ácido dimetil sulfúrico y ácido dietilsulfúrico. La cantidad de uso del reactivo electrófilo se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,1 a 1,0 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol del compuesto de fórmula [1a].

La base que se puede usar se puede ejemplificar por medio de las mismas bases que se han descrito con respecto al procedimiento 1 del procedimiento de producción 1, y la cantidad de uso de la base se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol del compuesto de fórmula [1a].

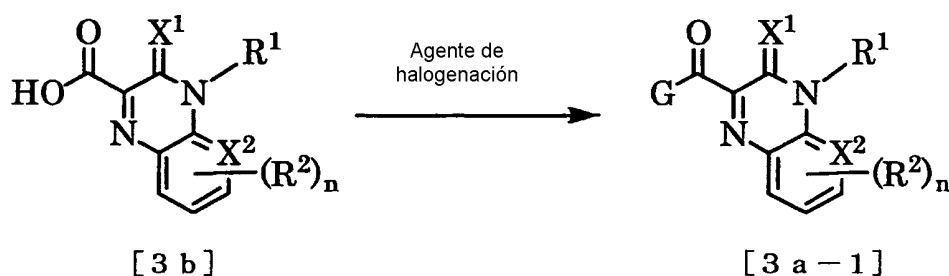
Se puede ejemplificar el disolvente que se puede usar por medio de los mismos disolventes que se describen con respecto al procedimiento 1 del procedimiento de producción 1.

La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -20°C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0°C a 100°C . El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 48 horas.

A continuación se describe el procedimiento para producir un intermedio para el compuesto de la presente invención.

Procedimiento 1 de producción de intermedio

[Fórmula Química 15]



en la que R^1 , R^2 , n , X^1 y X^2 tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente; y G representa un átomo de halógeno tal como cloro o bromo.

La fórmula [3a-1] que es un intermedio de producción para el compuesto de la presente invención, se puede producir haciendo reaccionar la fórmula [3b] con un agente de halogenación apropiado en un disolvente o sin disolvente.

Como agente de halogenación que se puede usar en el presente procedimiento, se puede incluir, por ejemplo, cloruro de oxalilo, cloruro de tionilo y similares.

La cantidad de uso de agente de halogenación se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 100 moles, y preferentemente de 0,1 a 100 moles, basado en un mol de la fórmula [3b].

Ejemplos de disolventes incluyen hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y cloroformo; éteres tales como éter dietílico y tetrahidrofurano; e hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno.

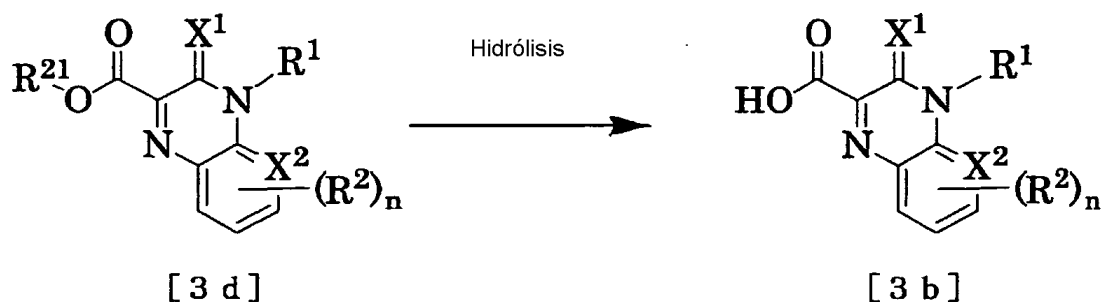
La cantidad de uso del disolvente es de 0 a 100 l, y preferentemente de 0,001 a 10 l, basado en un mol de la fórmula [3b].

Se puede escoger la temperatura de reacción dentro del intervalo de -100°C a 200°C y preferentemente se escoge para que sea de 0°C a 100°C .

El tiempo de reacción puede variar con la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 24 horas.

Procedimiento de producción de intermedio 2

[Fórmula Química 16]



en la que R^1 , R^2 , n , X^1 y X^2 tienen respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente; y R^{21} representa un grupo alquilo inferior, un grupo bencilo que puede estar sustituido o un grupo fenilo que puede estar sustituido.

El intermedio de producción de fórmula [3b] se puede producir hidrolizando la fórmula [3b] en agua o en una mezcla de disolventes, en presencia de un ácido o en presencia de una base.

Como base que se puede usar en el presente procedimiento, se puede incluir, por ejemplo, bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio e hidróxido de sodio; y bases orgánicas tales como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undeceno.

La cantidad de uso de la base se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 100 moles y preferentemente de 0,1 a 10 moles, basado en un mol del compuesto [3d].

Como ácido que se puede usar en el presente procedimiento, se pueden incluir, por ejemplo, ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico y ácido sulfúrico; y ácidos orgánicos tales como ácido acético y ácido trifluoroacético.

La cantidad de uso de ácido puede ser de 1 mol hasta un gran exceso, y preferentemente de 1 a 100 moles, basándose en un mol del compuesto de fórmula [3d].

La mezcla de disolventes que se puede usar en el presente procedimiento es una mezcla de disolventes de agua y un disolvente orgánico, y ejemplos del disolvente orgánico incluyen alcoholes tales como metanol y etanol; éteres tales como tetrahidrofurano; cetonas tales como acetona y metilisobutil cetona; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; acetonitrilo; y sus mezclas.

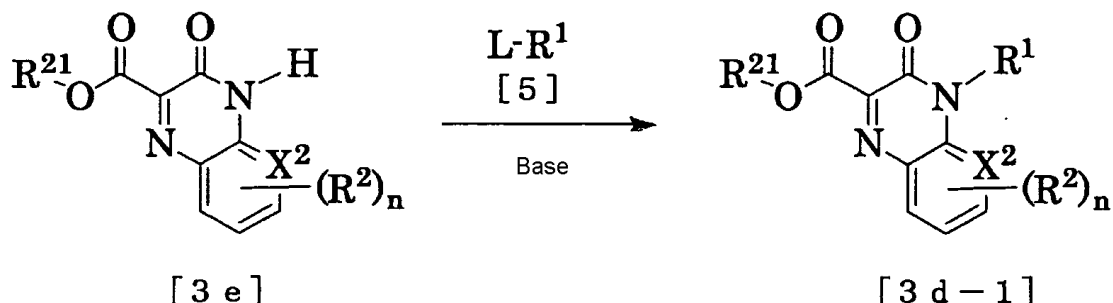
La cantidad de uso del disolvente es de 0,01 a 100 l y preferentemente de 0,1 a 10 l, basado en un mol de la fórmula [3d].

La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -100 a 200°C , y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0°C a 100°C .

El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 20 minutos a 24 horas.

Procedimiento de producción de intermedio 3

[Fórmula Química 17]



en la que L representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un grupo alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, un grupo alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, un grupo bencilsulfonilo que puede estar sustituido, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido, un grupo fenilsulfonilo que puede estar sustituido, o un grupo bencilsulfonilo que puede estar sustituido; y R^1 , R^2 , R^{21} , n y X^2 respectivamente presentan el mismo significado que se ha definido anteriormente; con la condición de que cuando R^1 es un grupo haloalquilo, L representa un grupo saliente que tiene mayor reactividad que el átomo de halógeno restante tras la halogenación. Por ejemplo, cuando R^1 es un grupo CHF_2 , L representa un átomo de cloro o un átomo de bromo, y cuando R^1 es un grupo CH_2CF_3 , L representa un grupo saliente tal como un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo p-toluensulfonilo, un grupo metilsulfonilo o un grupo trifluorometanosulfonilo.

Se puede producir el intermedio de producción para la fórmula [3d-1] haciendo reaccionar la fórmula [3e] con la fórmula [5] en presencia o en ausencia de una base, en un disolvente o sin disolvente.

La cantidad de uso de la fórmula [5] usada en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 100 moles, y preferentemente de 0,1 a 10 moles, basándose en un mol de fórmula [3e].

Como base que se puede usar en el presente procedimiento se pueden incluir, por ejemplo, carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio y hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidróxido de potasio e hidruro de sodio; alcoholatos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y metóxido de sodio; y bases orgánicas tales como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno.

La cantidad de uso de la base que se puede usar en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0 a 100 moles, y preferentemente de 0,1 a 100 moles, basado en un mol de la fórmula [3e].

Como disolvente que se puede usar en el presente procedimiento, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y cloroformo; éteres tales como éter dietílico y tetrahydrofurano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; cetonas tales como acetona y metil isobutil cetona; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de metilo; amidas tales como N-metilpirrolidona y N,N-dimetilformamida; compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; nitrilos tales como acetonitrilo; y sus mezclas.

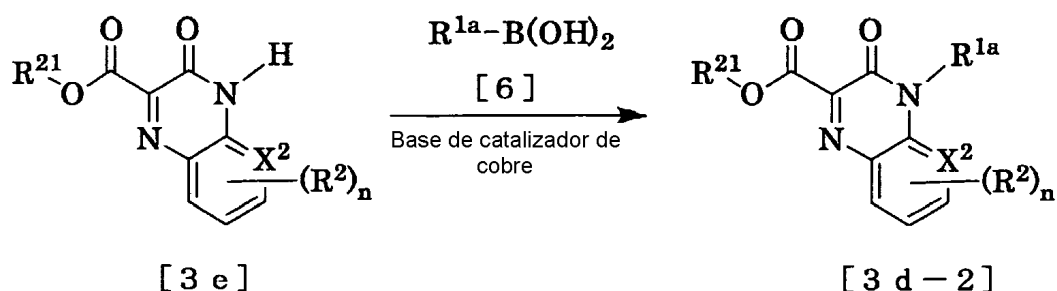
La cantidad de uso del disolvente que se puede usar en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0 a 100 l, y preferentemente de 0 a 10 l, basado en un mol de la fórmula [3e].

La temperatura de reacción del presente procedimiento se puede escoger dentro del intervalo de $-100\text{ }^\circ\text{C}$ hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de $-20\text{ }^\circ\text{C}$ hasta $100\text{ }^\circ\text{C}$.

El tiempo de reacción del presente procedimiento puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 1 hora a 168 horas.

Procedimiento de producción de intermedio 4

[Fórmula Química 18]

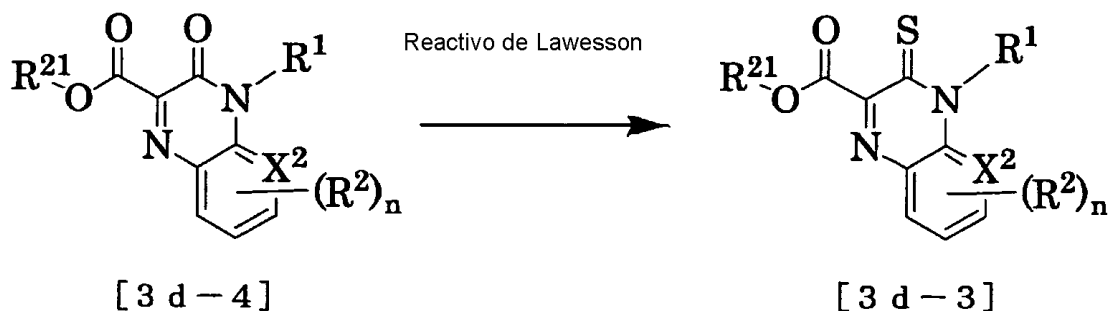


en la que R^{1a} representa un grupo arilo C_6-C_{10} o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno; y R^2 , R^{21} , n y X^2 presentan respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente.

- 5 Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [3d-2] haciendo reaccionar la fórmula [3e] con la fórmula [6] en presencia de un catalizador de cobre y una base, de acuerdo con el procedimiento descrito en Tetrahedron, Vol. 55, pp. 12757-12770 (1999).

Procedimiento de producción de intermedio 5

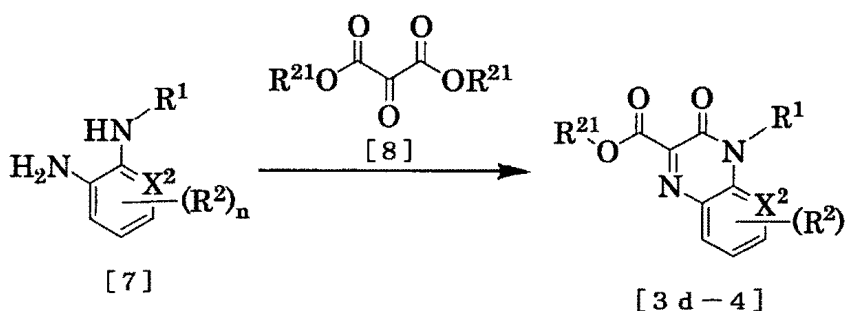
[Fórmula Química 19]



- 10 en la que R^1 , R^2 , R^{21} , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente. Se puede producir el intermedio de producción de la fórmula [3d-3] haciendo reaccionar el compuesto representado por medio de la fórmula [3d-4] con un reactivo de Lawesson, de acuerdo con el procedimiento descrito en el documento US 2005/256000.

Procedimiento de producción de intermedio 6

[Fórmula Química 20]

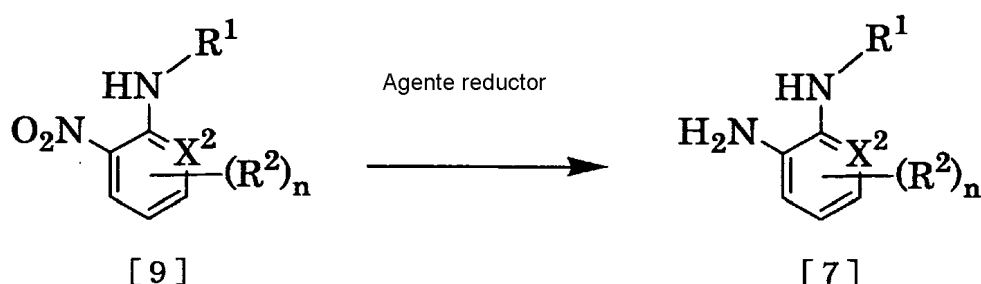


en la que R^1 , R^2 , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente.

Se puede producir el intermedio de producción de la fórmula [3d-4] haciendo reaccionar el compuesto representado por medio de la fórmula [7] con un diéster de ácido cetomalónico representado por medio de la fórmula [8], de acuerdo con los procedimientos descritos en US 6329389, US 6348461: Journal of the Chemical Society, pp. 430-439 (1957); WO 2005/21547, US 4296114; Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 75-84 (1987) y similares.

Procedimiento de producción de intermedio 7

[Fórmula Química 21]

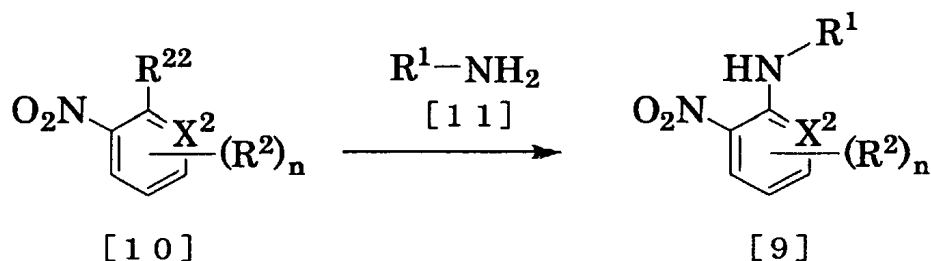


en la que R^1 , R^2 , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente.

Se puede producir la fórmula [7] haciendo reaccionar un compuesto nitro representado por medio de la fórmula [9] de acuerdo con las descripciones de Lectures on Experimental Chemistry, 4ª edición, Vol. 26, "Reduction in General", publicado por Maruzen Co., Ltd.

Procedimiento de producción de intermedio 8

[Fórmula Química 22]

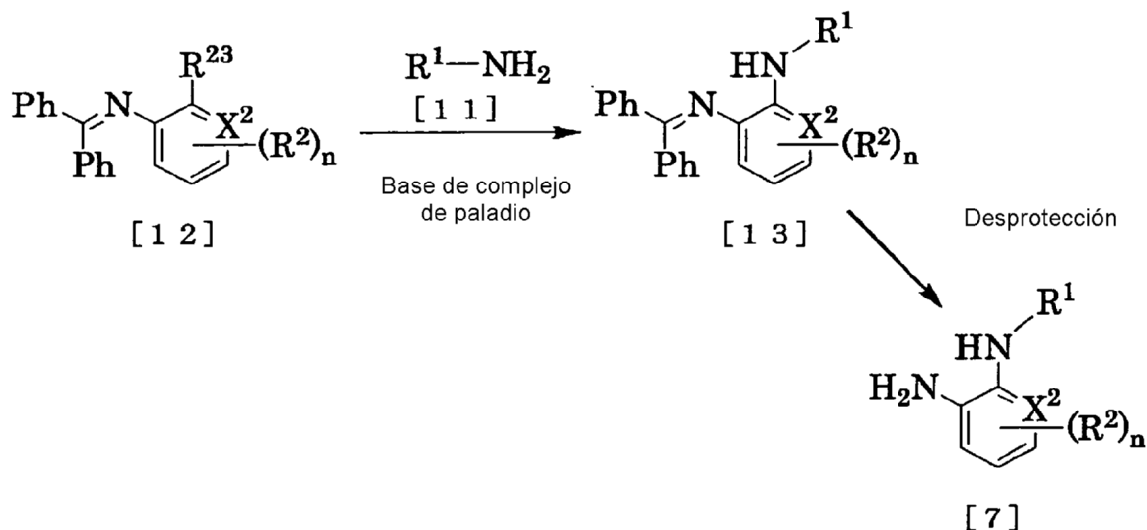


en la que R^1 , R^2 , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente; y R^{22} representa un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro o un átomo de bromo.

Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [9] haciendo reaccionar la fórmula [10] con la fórmula [11] de acuerdo con los procedimientos descritos en WO 2004/817, US 6348461; Journal of Medicinal Chemistry, Vol 41, pp. 5457-5465 (1998); Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 2387-2391 (1980) y similares.

Procedimiento de producción de intermedio 9

[Fórmula Química 23]



en la que R^1 , R^2 , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente; y R^{23} representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.

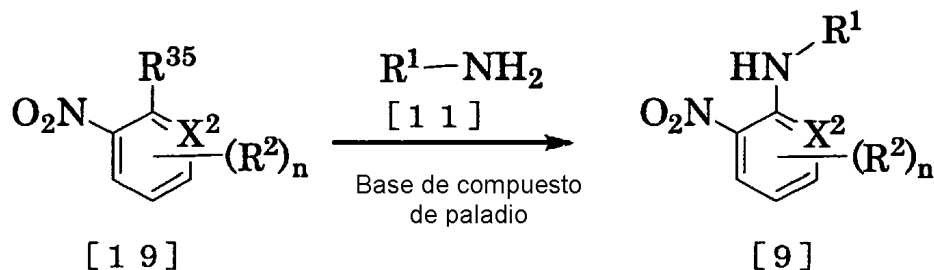
Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [7] por medio del procedimiento mostrado anteriormente.

- 5 Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [13] haciendo reaccionar un compuesto representado por medio de la fórmula [12] con un compuesto representado por medio de la fórmula [11] en presencia de un complejo de paladio y una base, de acuerdo con los procedimientos descritos en Journal of Organic Chemistry, Vol. 65, pp. 1144-1157 (2000); Journal of Organic Chemistry, Vol. 65, pp. 1158-1174 (2000) y similares.

- 10 También se puede producir el intermedio de producción de la fórmula [7] desprotegiendo el grupo amino del compuesto representado por medio de la fórmula [13], de acuerdo con los procedimientos descritos en Tetrahedron Letters, pp. 2641-2644 (1978); Synthesis, pp. 359-363; Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 3081-3084 (1988) y similares.

Procedimiento de producción de intermedio 10

[Fórmula Química 24]

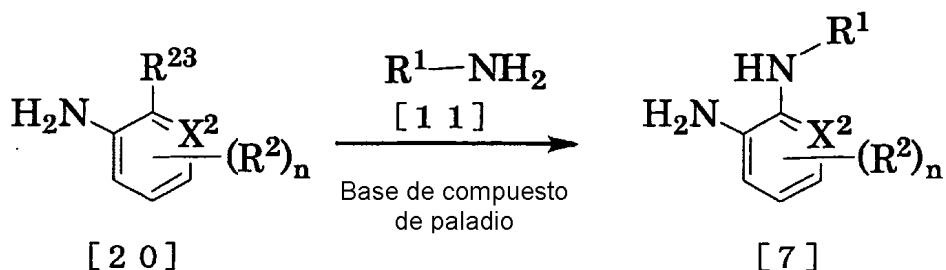


- 15 en la que R^1 , R^2 , R^{23} , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente; y R^{35} representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.

Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [7] haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [19] con el compuesto de fórmula [11] en presencia de un complejo de paladio y una base, de acuerdo con el procedimiento para la producción del intermedio de producción de fórmula [13] en el procedimiento de intermedio de producción 9.

- 20 Procedimiento de producción de intermedio 11

[Fórmula Química 25]

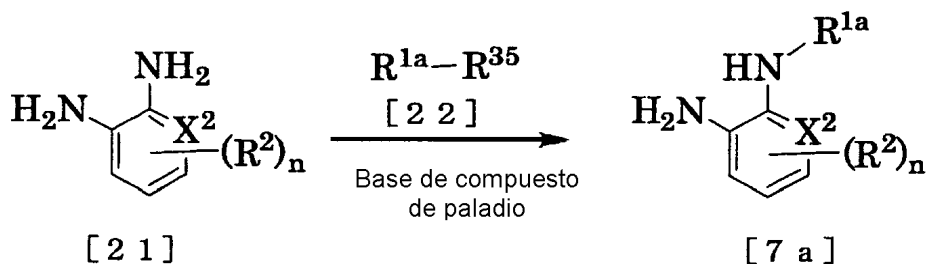


en la que R^1 , R^2 , R^{23} , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente.

Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [7] haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [20] con el compuesto de fórmula [11] en presencia de un complejo de paladio y una base, de acuerdo con el procedimiento para la producción del intermedio de producción de fórmula [13] en el procedimiento de intermedio de producción 9.

Procedimiento de producción de intermedio 12

[Fórmula Química 26]

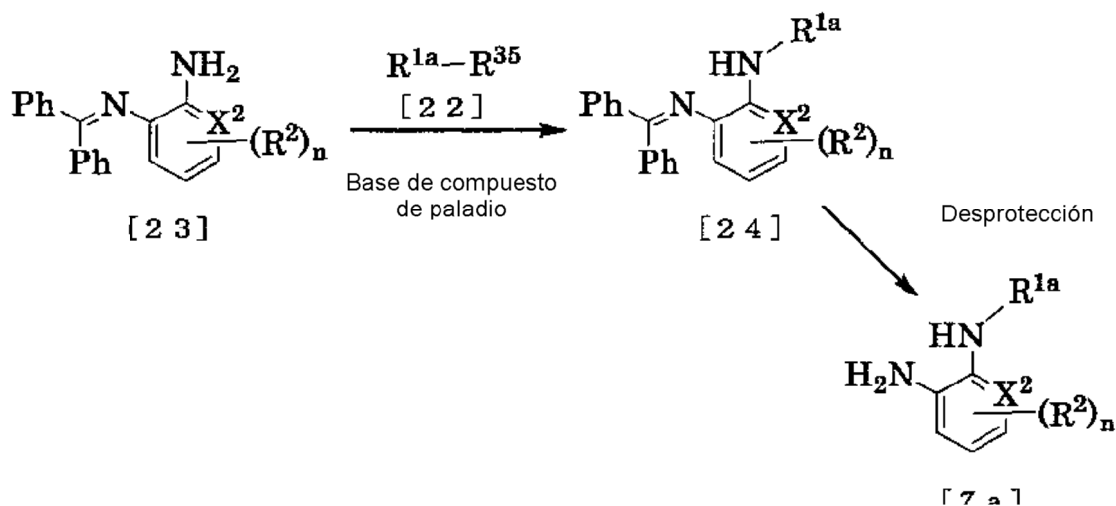


en la que R^{1a} , R^2 , R^{35} , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente;

Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [7a] haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [21] con el compuesto de fórmula [22] en presencia de un complejo de paladio y una base, de acuerdo con el procedimiento para la producción del intermedio de producción de fórmula [13] en el procedimiento de intermedio de producción 9.

Procedimiento de producción de intermedio 13

[Fórmula Química 27]

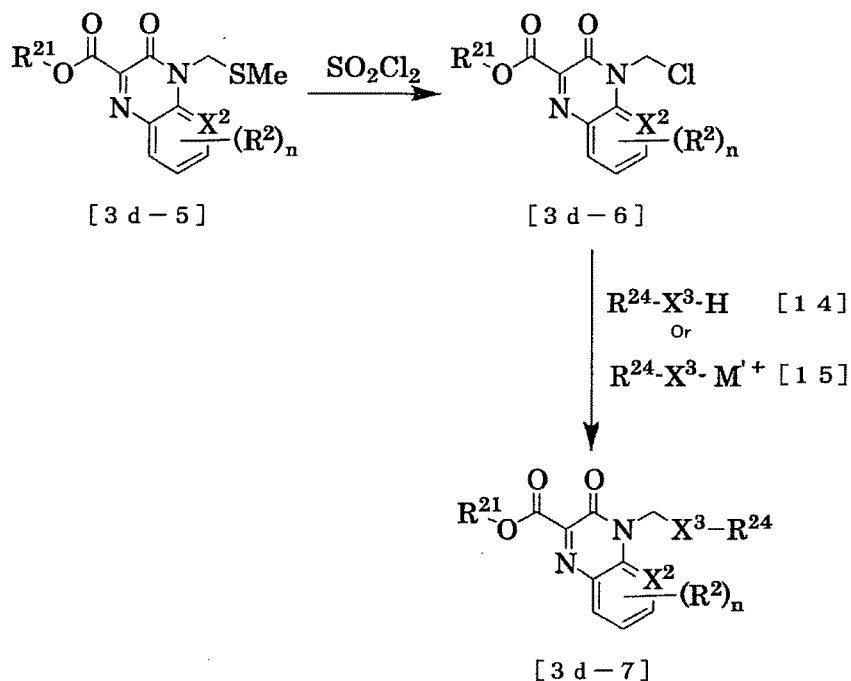


en la que R^{1a} , R^2 , R^{35} , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente.

Se puede producir también el intermedio de producción de fórmula [7a] desprotegiendo el grupo amino del compuesto representado por medio de la fórmula [24] que se produce haciendo reaccionar el compuesto de fórmula [23] con el compuesto de fórmula [22] en presencia de un complejo de paladio y una base, de acuerdo con el procedimiento de producción de intermedio 9.

Procedimiento de producción de intermedio 14

[Fórmula Química 28]



en la que R^2 , R^{21} , n y X^2 presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente; R^{24} representa un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo cicloalquiloxi C_3-C_6 , un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , un grupo fenoxi, un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 , un grupo alquilsulfonyl C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 , un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 , un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5

heteroátomos, que pueden ser iguales o diferentes, escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, o un grupo alquiltio C₁-C₆; M⁺ representa un catión de metal alcalino; y X³ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

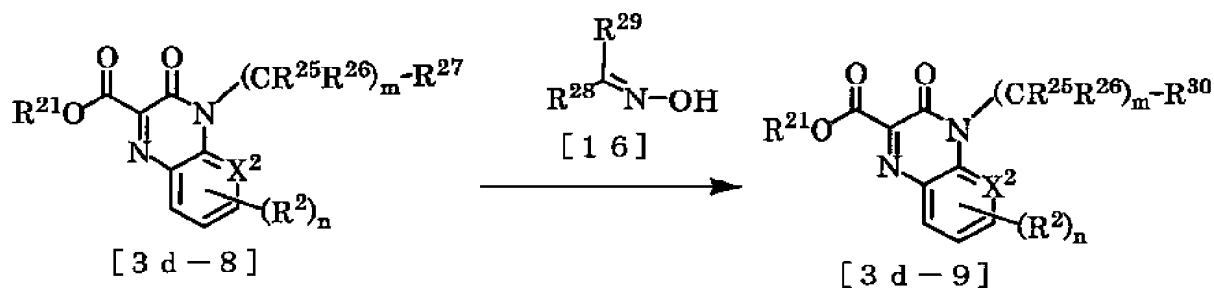
Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [3d-7] por medio del procedimiento que se ha mostrado anteriormente.

De manera específica, se puede producir la fórmula [3d-6] haciendo reaccionar la fórmula [3d-5] con cloruro de sulfurilo de acuerdo con los procedimientos descritos en US 2003/195169; Tetrahedron Letters, Vol. 37, Nº. 6, pp. 759-762 (1996) y similares.

Se puede producir la fórmula [3d-7] haciendo reaccionar la fórmula [3d-6] con un compuesto representado por medio de la fórmula [14] o la fórmula [15], de acuerdo con los procedimientos descritos en US 5155272, EP-1228067, US 4058392; Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 781-790 (1987) y similares.

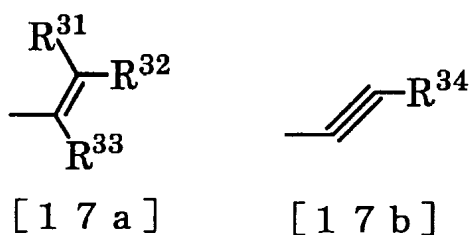
Procedimiento de producción de intermedio 15

[Fórmula Química 29]



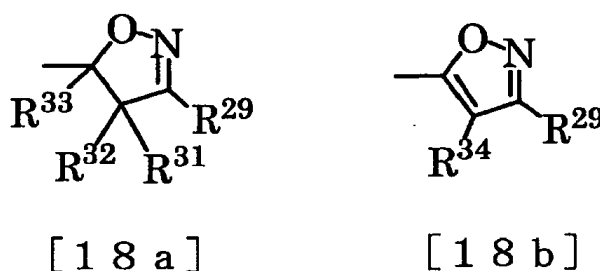
en la que R², R²¹, X² y n presentan respectivamente los significados que se han definido anteriormente; R²⁷ representa un grupo representado por medio de la fórmula siguiente [17a] o la fórmula [17b]:

[Fórmula Química 30]



R³⁰ representa un grupo representado por medio de la fórmula [18a] o [18b]

[Fórmula Química 31]

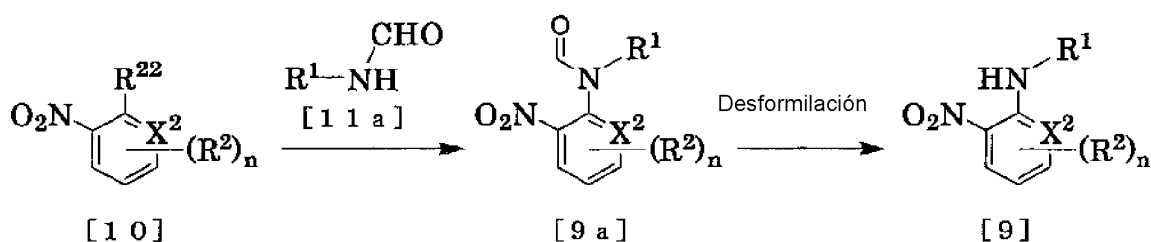


en la que R^{25} , R^{26} , R^{31} , R^{32} , R^{33} y R^{34} representan cada uno de manera independiente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo, un grupo alquenilo, un grupo alquinilo, un grupo cicloalquilo o un grupo haloalquilo; R^{29} representa un grupo alquilo, un grupo alquenilo, un grupo alquinilo, un grupo alcoxi, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo o un grupo haloalquenilo; R^{28} representa un átomo de halógeno; y t representa un número entero de 0 a 6; con la condición de que cuando R^{27} es la fórmula [17a], R^{30} es la fórmula [18a] y cuando R^{27} es la fórmula [17b], R^{30} es la fórmula [18b].

Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [3d-9] haciendo reaccionar la fórmula [3d-8] con la fórmula [16] de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2005/26123; Tetrahedron, Vol. 40, p. 2985 (1984); Synthetic Communications, Vol. 18, pp. 1171 (1988) y similares.

Procedimiento de producción de intermedio 16

[Fórmula Química 32]



en la que R^1 , R^2 , R^{22} , n y X^2 presentan respectivamente los mismos significados que se han definido anteriormente. También se puede producir el intermedio de producción de fórmula [9] por medio del procedimiento mencionado anteriormente.

Se puede producir el intermedio de producción de la fórmula [9a] haciendo reaccionar la fórmula [10] con la fórmula [11a] en presencia de una base, en un disolvente o sin disolvente.

La cantidad de uso de la fórmula [11a] según se usa en el presente procedimiento se puede escoger de manera apropiada dentro del intervalo de 0,1 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,1 moles, basándose en un mol de la fórmula [10].

Como base que se puede usar en el presente procedimiento, por ejemplo, se pueden incluir carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio o carbonato de potasio; hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de potasio o hidruro de sodio; alcoholatos de metal alcalino tales como etóxido de sodio o metóxido de sodio; o bases orgánicas tales como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno y similares.

La cantidad de uso de base según se usa en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,1 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,1 moles, basándose en un mol de la fórmula [10].

Como disolvente que se puede usar en el presente procedimiento, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y cloroformo; éteres tales como éter dietílico y tetrahidrofurano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; cetonas tales como acetona y metil isobutil cetona; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de metilo; amidas tales como N-metilpirrolidona y N,N-dimetilformamida; compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; nitrilos tales como acetonitrilo; y sus mezclas.

La cantidad de uso del disolvente que se puede usar en el presente procedimiento se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0 a 100 l, y preferentemente de 1 a 2 l, basado en un mol de la fórmula [10].

La temperatura de reacción del presente procedimiento se puede escoger dentro del intervalo de -100 °C hasta la zona del punto de ebullición del disolvente inerte usado, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 15 °C hasta 140 °C.

El tiempo de reacción del presente procedimiento puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 1 hora a 168 horas.

De manera adicional, se puede producir el intermedio de producción de fórmula [9] mediante desformilación de la fórmula [9a] en agua o una mezcla de disolventes, en presencia de un ácido o en presencia de una base.

Como base que se puede usar en el presente procedimiento, se puede incluir, por ejemplo, bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio e hidróxido de sodio; y bases orgánicas tales como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undeceno.

La cantidad de uso de la base se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,1 a 10 moles, y preferentemente de 1,0 a 1,2 moles, basándose en un mol del compuesto [9a].

Como ácido que se puede usar en el presente procedimiento, se pueden incluir, por ejemplo, ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico y ácido sulfúrico; y ácidos orgánicos tales como ácido acético y ácido trifluoroacético.

La cantidad de uso del ácido puede ser de 1 mol hasta un gran exceso, y preferentemente de 1 a 100 moles, basándose en un mol del compuesto de fórmula [9a].

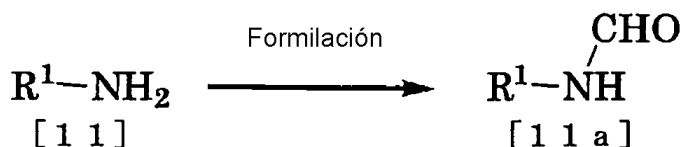
La mezcla de disolventes que se puede usar en el presente procedimiento es una mezcla de disolventes de agua y un disolvente orgánico, y ejemplos del disolvente orgánico incluyen alcoholes tales como metanol y etanol; éteres tales como tetrahidrofurano; cetonas tales como acetona y metilisobutil cetona; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; acetonitrilo; y sus mezclas.

La cantidad de uso del disolvente es de 0,1 a 100 l y preferentemente de 1,0 a 10 l, basado en un mol de la fórmula [9a]. La temperatura de reacción se puede escoger dentro del intervalo de -100 a 200 °C, y preferentemente se escoge dentro del intervalo de 0 °C a 100 °C.

El tiempo de reacción puede variar dependiendo de la temperatura de reacción, el sustrato de reacción, el alcance de la reacción y similares, pero normalmente es de 10 minutos a 24 horas.

Procedimiento de producción de intermedio 17

[Fórmula Química 33]



en la que R¹ tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente.

Se puede producir el intermedio de producción de fórmula [11a] por medio de formilación de la fórmula [11], de acuerdo con el procedimiento descrito en Journal of the American Chemical Society, Vol. 80, pp. 1154 y el documento de US 2004/198981.

El herbicida y la composición agroquímica de la presente invención se caracterizan por contener el derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [I] de la presente invención o una de sus sales aceptables desde el punto de vista agroquímico, como ingrediente activo. La presente invención también se refiere a una composición agroquímica, más particularmente a una composición de herbicida, que contiene un derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [I] de la presente invención, o uno o dos o más de sus sales aceptables agroquímicamente y un vehículo cuyo uso se encuentra permitido en las preparaciones agroquímicas.

El herbicida de la presente invención puede contener componentes aditivos (vehículo) que se usan convencionalmente en las preparaciones agroquímicas, según sea necesario.

Ejemplos de componentes aditivos incluyen vehículos tales como vehículos sólidos o vehículos líquidos, tensioactivos, aglutinantes o agentes que confieren adhesividad, espesantes, colorantes, agentes de expansión, agentes de dispersión, agentes anticongelantes, agentes anti-apelmazantes, desintegrantes, estabilizadores y similares. Además de estos, también se pueden usar antisépticos, trozos de plantas y similares como componentes aditivos de acuerdo con la necesidad.

Estos componentes aditivos se pueden usar de manera individual, o también se pueden usar en combinación de dos o más especies.

Se discuten los componentes aditivos mencionados anteriormente.

Ejemplos de vehículo sólido incluyen minerales de origen natural tales como cuarzo, arcilla, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita y tierras diatomeas, sales inorgánicas tales como carbonato de calcio, sulfato de amonio, sulfato de sodio y cloruro de potasio; vehículos sólidos orgánicos tales como ácido silícico sintético, silicatos sintéticos, almidón, celulosas y polvos de plantas; vehículos plásticos tales como poli(cloruro de etileno, propileno y vinilideno); y similares. Se pueden usar de forma individual, o se pueden usar en combinación de dos o más especies.

Ejemplos de vehículo líquido incluyen alcoholes que se clasifican en gran medida como alcoholes monohídricos tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol y butanol; y poli(alcoholes hídricos) tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol y glicerina; derivados de poli(alcoholes hídricos) tales como éteres de glicol basados en propileno; cetonas tales como acetona, etil metil cetona, isobutil metil cetona, diisobutil cetona, ciclohexanona e isoforona; éteres tales como éter etílico, dioxano, celusolve, éter

- dipropílico y tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos tales como parafina normal, nafteno, isoparafina, queroseno y aceite mineral; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, nafta de disolvente y alquilnaftaleno; hidrocarburos halogenados tales como dicloroetano, cloroformo y tetraclorocarbono; ésteres tales como acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo y adipato de dimetilo; lactonas tales como γ -butirolactona; amidas tales como dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida y N-alquilpirrolidinona; nitrilos tales como acetonitrilo; compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido; aceites de plantas tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón y aceite de ricino; agua; y similares. Estos se pueden usar de forma individual, o se pueden usar en combinación de dos o más especies.
- El tensioactivo no se encuentra particularmente limitado, pero preferentemente es un tensioactivo que forma gel o muestra capacidad de hinchamiento en agua. Sus ejemplos incluyen tensioactivos no iónicos tales como ésteres de ácido graso de sorbitán, ésteres de ácido graso de sorbitán de polioxietileno, ésteres de ácido graso de sacarosa, ésteres de ácido graso de polioxietileno, ésteres de ácido de resina de polioxietileno, diésteres de ácido graso de polioxietileno, éteres de alquilo de polioxietileno, éteres de fenilo de polioxietileno, éteres de dialquilfenilo de polioxietileno, condensados de formalina-éter de alquilo y fenilo de polioxietileno, polímeros de bloques de polioxietileno-polioxipropileno, éteres de polímeros de bloques de alquil polioxietileno-polipropileno, alquilaminas de polioxietileno, amidas de ácido graso de polioxietileno, éteres de bisfenilo de ácido graso de polioxietileno, éteres de fenilo y bencilo de polialquilenos, éteres de fenilo y estirilo de polioxialquilenos, acetilendiol, acetilendiol de adición de polioxialquilenos, silicionas de tipo éter de polioxietileno, siliconas de tipo éster, tensioactivos basados en flúor, aceite de ricino de polioxietileno y aceite de ricino halogenado de polioxietileno; tensioactivos aniónicos tales como sulfato de alquilo, sulfatos de éter de alquilo de polioxietileno, sulfatos de éter de alquilo y fenilo de polioxietileno, sulfatos de éter de fenilo de estirilo de polioxietileno, bencenosulfonatos de alquilo, sulfonatos de lignina, sulfosuccinatos de alquilo, naftalensulfonatos, naftalensulfonatos de alquilo, condensado de sales de ácido naftalensulfónico-formalina, condensado de sales de ácido alquil naftalensulfónico-formalina, sales de ácido graso, sales de poli(ácido carboxílico), sarcosinato de ácido N-metil-graso, sales de ácido de resina, fosfatos de éter de alquilo de polioxietileno y fosfatos de éter de alquilo y fenilo de polioxietileno; tensioactivos catiónicos tales como sales del alquilamina tales como hidrocloruros de laurilamina, hidrocloruros de estearilamina, hidrocloruros de oleilamina, acetatos de estearilamina, acetatos de estearilaminopropilamina, cloruros de alquiltrimetilamonio y cloruros de alquildimetilbenzalconio; tensioactivos anfóteros tales como los de tipo de amino ácido o tensioactivos de tipo betaína; y similares.
- Ejemplos de aglutinantes o agentes que confieren adhesividad incluyen carboximetilcelulosa o sus sales, dextrina, almidón soluble en agua, goma xantán, goma guar, sacarosa, polivinilpirrolidona, goma arábica, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), poli(acrilato de sodio), polietilenglicol que tiene un peso molecular medio de 6000 a 20000, poli(óxido de etileno) que tiene un peso molecular medio de 100000 a 5000000, fosfolípidos de origen natural (por ejemplo, ácido cefálico, lecitina, etc.) y similares.
- Ejemplos de espesantes incluyen polímeros solubles en agua tales como goma xantán, goma guar, carboximetilcelulosa, polivinilpirrolidona, polímeros de carboxivinilo, polímeros acrílicos, derivados de almidón y polisacáridos; polvos finos inorgánicos tales como bentonita de alta pureza y carbono blanco; y similares.
- Ejemplos de colorantes incluyen pigmentos inorgánicos tales como óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia; pigmentos orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azo y colorantes de ftalocianina de metal; y similares.
- Ejemplos de agentes expansores incluyen tensioactivo basados en silicona, celulosas en forma de polvo, dextrina, almidón procesado, compuestos quelato de poli(ácido aminocarboxílico), polivinilpirrolidona reticulada, ácido maléico y estirenos, copolímeros de ácido metacrílico, ésteres medios y de polímero poli(alcohol hídrico) y anhídrido de ácido dicarboxílico, sales solubles en agua de poli(ácido estirensulfónico) y similares.
- Ejemplos de agentes de dispersión incluyen varios tensioactivos tales como dialquilsulfosuccinato de sodio, poli(éteres de alquil oxietileno), poli(éteres de alquil fenil oxietileno) y poli(ésteres de ácido graso de oxietileno); parafinas, terpenos, poli(resinas de amida), poli(acrilatos), polioxietileno, ceras, poli(éteres de alquilo y vinilo), condensados de alquilfenol-formalina, emulsiones de resinas sintéticas y similares.
- Ejemplos de agentes anti-congelantes incluyen poli(alcoholes hídricos) tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol y glicerina; y similares.
- Ejemplos de agentes anti-apelmazantes incluyen polisacáridos tales como almidón, ácido algínico, manosa y galactosa; polivinilpirrolidona, carbono blanco, gomas de éster, resinas de petróleo y similares.
- Ejemplos de desintegrantes incluyen tripolifosfato de sodio, hexametáfosfato de sodio, sales de metal de ácido esteárico, celulosa en forma de polvo, dextrina, copolímeros de ésteres de ácido metacrílico, polivinilpirrolidona, compuestos quelatos de poli(ácido aminocarboxílico), copolímeros sulfonados de estireno-isobutileno-anhídrido maleico, copolímeros injertados de almidón-poliacrilonitrilo y similares.
- Ejemplos de estabilizadores incluyen agentes de secado tales como zeolitas, cal viva y óxido de magnesio; antioxidantes de tipo fenol, tipo amina, tipo azufre, tipo ácido fosfórico y similar; absorbentes ultravioleta de tipo

ácido salicílico, de tipo benzofenona y similar; y similares.

Ejemplos de antisépticos incluyen sorbato de potasio, 1,2-benzotiazolin-3-ona y similares.

Ejemplos de trozos de plantas incluyen serrín, cáscara de coco, zuro de maíz, raspa de tabaco y similares.

5 En el caso de incorporar los componentes de aditivo en el herbicida de la presente invención, la proporción de contenido se escoge dentro del intervalo de normalmente 5 a 95 %, y preferentemente de 20 a 90 %, para el vehículo; normalmente de 1 % a 30 % y preferentemente de 0,5 % a 10 %, para el tensioactivo; y normalmente de 0,1 a 30 %, y preferentemente de 0,5 a 10 % para los otros aditivos, todos basados en la masa de herbicida.

10 El herbicida de la presente invención se usa tras ser formulado en cualquier formulación tal como formulación líquida, un concentrado apto para emulsión, una formulación en forma de polvo humectable, una formulación de polvo, una formulación de aceite, una formulación de gránulo dispersable, una formulación apta para fluir, una suspensión emulsionada, una formulación de gránulo, una formulación de performance, una suspo-emulsión o una formulación de Mametsubu (nombre comercial registrado).

15 Durante la presente formulación, se puede preparar el herbicida para dar lugar a una composición mixta con al menos uno de los agroquímicos tales como herbicidas, insecticidas, bactericidas y reguladores del desarrollo de plantas, protectores, fertilizantes y similares, o se puede usar el herbicida en combinación con los presentes compuestos.

En el momento de uso, el herbicida de la presente invención se puede diluir hasta una concentración apropiada y se puede pulverizar o se puede aplicar directamente.

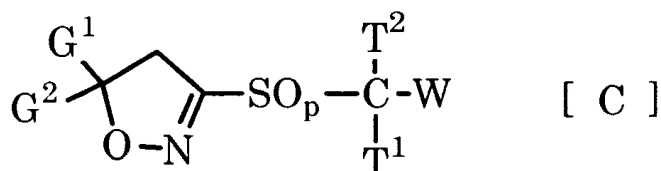
20 Se pueden usar el derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [I] de la presente invención o una de sus sales aceptables desde el punto de vista agroquímico solos como ingrediente activo, pero también se puede usar como mezcla o en combinación con otros ingredientes activos.

Ejemplos de compuestos herbicidas conocidos y reguladores del desarrollo de plantas que se pueden mezclar o usar en combinación se listan entre los siguientes.

25 2,3,6-TBA, 2,4-D, 2,4-DB, DNOC, EPTC, etoxifen-etilo, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, S-metaloclor, TCA, ioxinilo, acclonifeno, azefenidina, acifluorfen, azimsulfuron, asulamo, acetoclor, atrazina, anilofos, amicarbazona, amidosulfuron, amitrol, aminopirialid, amiprofos-metilo, ametrina, alaclor, aloxidim, ancimidol, yodosulfuron-metil-sodio, isouron, isoxaclorol, isoxaflutol, isoxabeno, isoproturon, imazaquina, imazapir, imazametabenz-metilo, imazapic, imazamox, imazatapir, imzasulfuron, indanofan, esprocarb, etametsulfuron-metilo, etalfluralina, etidimuron, etoxisulfuron, etofumesato, etobenzanid, oxadiazon, oxadiargilo, oxaziclomefona, oxasulfuron, oxzifluorfen, orizalina, orbencarb, cafenstrol, carfentrazon-etilo, karbutilato, carbetamida, quizalofon, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, quizalofop-etilo, quincloclor, quinmerac, cumiluron, glifosato, glifosato-trimesio, glufosinato-amonio, glufosinato-sodio, cletodim, clodinafop-propargilo, clopiralid, clomazona, clometoxifeno, clomeprop, cloransulamo-metilo, clorabeno, cloridazon, clorimuron-etilo, clorosulfuron, clortal-dimetilo, clortiamid, cloropropam, cloromequat, cloruro, cloroxuron, clorotoluron, clorobromuron, cianazina, diuron, dicamba, cicloato, cicloxidim, diclosulam, ciclosulfamuron, diclobenilo, diclofop-metilo, diclorprop, diclorprop-P, diquatdibromuro, ditopir, siduron, dinitramina, cinidon-etilo, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, cihalofop-butilo, difenamid, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflumentorim, simazina, dimetaclor, dimetametrina, dimetanamid, simetrina, dimepiperato, dimefuron, cinmetilina, sulcotriona, sulfentrazona, sulfosulfuron, sulfometuron-metilo, setoxidim, terbacilo, daimuron, dalapon, tiazopir, tiocarbazil, tiobencarb, tiadiazimina, tidiazuron, tifensulfuron-metilo, desmedifam, desmetrina, tenilclor, tebutamo, tebutiuron, tepraloxidim, tefuriltrion, terbutilazina, terbutrina, terbumeton, tembotriona, topamezona, tralkoxidim, triaziflam, triasulfuron, trialato, trietazina, triclopir, triflusulfuron-metilo, tritosulfuron, trifluralina, trifloxisulfuron-sodio, tribenuron-metilo, naftalamo, naproanilida, napropamida, nicosulfuron, neburon, norflurazon, vernolato, dicloruro de paraquat, haloxyfop, haloxyfop-P-metilo, halsulfuron-metilo, pinoxaden, picloramo, picolinafeno, bispiribac-sodio, bifenox, piperofos, piraclonilo, pirasulfotol, pirazoxifeno, pirazosulfuron-etilo, pirazolinato, bilanafos, piraflufen-etilo, piridafol, piritiobac-sodio, piridato, piritalid, piributicarb, piribenzoxim, pirmsulfan, pirmsulfuron-metilo, piriminocarb-metilo, piroxisulamo, fenuron, fenoxaprop-P-etilo, fenoxaprop-etilo, fenclorim, fentrazamida, fenedifamo, foramsulfuron, butaclor, butafenacilo, butamifos, butilato, butralina, butroxidim, flazasulfuron, flamprop-M, fluzafop-butilo, fluzaprop-P-butilo, fluzalotao, flumeturon, fluoroglicofeno-etilo, flucarbazon-sodio, flucetosulfuron, flutiacet-metilo, flupirsulfuron-metil-sodio, flufenacet, flufenperi-etilo, flupropanato, flupoxamo, flumioxazina, flumiclorac-pentilo, flumetsulamo, fluridona, flurtamona, flurprimidol, fluroxipir, flurocloridona, pretilaclor, prodiamina, prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propaclor, propazina, propanilo, propizamida, propisoclor, profamo, bromofenoxim, bromobutida, florasulamo, hexazinona, petoxamid, benazolina, penoxsulamo, beflubutamid, pebulato, bencarbazona, pendimetilina, benzfendizona, bensulide, bensulfuron-metilo, benzobiciclon, benzofenap, bentazona, pentanoclor, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, formesafeno, forclorfenuron, hidrazida maleica, mecoprop, mecoprop-P, mesosulfuron-metilo, mesotriona, metazaclor, metabenzthiazuron, metamitron, metamifop, metil-dimuron, metoxuron, metosulamo, metsulfuron-metilo, metabromuron, metobenzuron, metolaclo, metribuzina, cloruro de mepiquat, mefenacet, monolinuron, molinato, lactofeno, linuron, rimsulfuron, lenacilo, prohexadiona-calcio,

trinexapac-etilo, piroxasulfona, un derivado de isoxazolina representado por medio de la fórmula siguiente [C]:

[Fórmula Química 34]



En la que p representa un número entero de 0 a 2: T¹ y T² representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alcóxicarbonilo inferior o un grupo alquilo C₁-C₆; G¹ y G² representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo haloalquilo C₁-C₆; W representa un grupo fenilo (sustituido con un 1 a 5 Vs idénticos o diferentes); y V representa un átomo de hidrógeno; se pueden incluir un grupo alquilo C₁-C₆ {que puede estar sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno idénticos o diferentes, un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo hidroxilo, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo alquilamino C₁-C₆, un grupo dialquilamino C₁-C₆, un grupo ciano o un grupo fenoxi (que puede estar sustituido)}, un grupo alcoxi C₁-C₆ (que puede estar sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno idénticos o diferentes, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alqueno C₁-C₆, un grupo alquino C₁-C₆, un grupo alcóxicarbonilo C₁-C₆, un grupo alquilcarbonilo o un grupo cicloalquilo C₃-C₈), un grupo cicloalcoxi C₃-C₈ o un átomo de halógeno y similares.

Además, ejemplos de compuestos bactericidas conocidos que se pueden mezclar o se pueden usar en combinación se listan a continuación.

Se pueden incluir, benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato, tiofanato-metilo, clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenarimol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, fultriafol, hexaconazol, imazalilo, imibenconazol, ipoconazol, metconazol, miclobutanilo, nuarimol, furmarato de oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, procloraz, propioconazol, protioconazol, pirfenox, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizona, triforina, triticonazol, benalaxilo, furalaxilo, mefenoxam, metalaxilo, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo, aldimorf, dodemorf, fenpropidina, fenpropimorf, piperalina, espiroxamina, tridemorf, edifenfos, iprobenfos, isoprotiolano, pirazofos, benodanilo, boscalid, carboxina, fenfuramo, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida, bupirimato, dimetirimol, etirimol, ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo, dietofencarb, azoxiestrobina, dimoxiestrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxaestrobina, creosim-metilo, metominoestrobina, orisaestrobina, picoxiestrobina, piracloestrobina, trifloxiestrobina, fenpiclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno, bifenilo, cloronebe, diclorano, etridiazol, quintoceno, tecnaceno, tolclofos-metilo, ftalide, piroquilon, triclozaz, carpropamid, diclocimet, fenoxamilo, fenhexamid, piributicarb, polioxina, pencicuron, ciazofamid, zoxamida, basticidina-S, casugamicina, estreptomina, validamicina, cimoxanilo, yodocarb, propamocarb, protiocarb, binapacril, dinocap, ferimzona, fluazianmo, TPTA (acetato de fentina), TPTC (cloruro de fentina), TPTH (hidróxido de fentina), ácido oxolínico, himexazol, octilina, fosetilo, ácido fosfórico y sus sales, tecloftalamo, triazóxido, flusulfamida, diclomezina, siltiofamo, diflumerim, bentiavalicarb-isopropilo, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandipropamid, oxitetraclina, metasulfocarb, quinometionato, fluoroimida, milneb, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, mancozeb, oxina-cobre, azufre, ferbamo, mancozeb, maneb, metiramo, propineb, tiram, zineb, ziram, captafol, captano, folpet, clorotalonilo, diclofluanid, tolifluanid, anilazina, dodina, guazatina, iminocadina, ditianon, acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo, etaboxamo, ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, fluopicolida, dazometk, difenzoquat, amisubrom, mezcla de Burdeos, F-991, narbamo, óxido de fenazina, policarbamato, piribencarb y similares.

Ejemplos de compuestos insecticidas y nematocidas que se pueden mezclar o se pueden usar en combinación se listan a continuación.

Se pueden incluir acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitempiramo, tiacloprid, tiametoxamo, etiprol, fipronilo, acetoprol, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, acrinatrina, aletrina, alfa-cipermetrina, beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bifentrina, bioaletrina, bioresmetrina, ciprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfevalerato, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, gamma-cihalotrina, imiprotrina, lambda-cihalotrina, metotrina, permotrina, fenotrina, praletrina, remestrina, cadetrina, taufluvinalato, teflutrina, tetrametrina, zeta-cipermetrina, tralometrina, transflutrina, etofenprox, halfenprox, silafluofeno, bensultap, cartap, tiociclam, tiosultap-sodio, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloroetoxifos, clorfenvifos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, dimetilinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos,

fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, isocarbofos, isoxation, malatión, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocroftos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration-metilo, pentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metil, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, pirafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion, imiciafos, flupirazofos, 5, aldicarb, bendiocarb, benfluacarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formtanato, furaticarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, trimetacarb, XMC, xililcarb, alanicarb, butocarboxim, butoxicarboxim, tiodicab, tiofanox, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron, abamectina, emamectina, clorfenapir, fenoxicarb, hidropreno, quinopreno, metopreno, piriproxifeno, dienoclor, cienopirafeno, 10, ciflumetofeno, espiromesifeno, espirodiclofeno, espirotetramat, flubendiamida, flurimfen (flurfenerim), flonicamid, metaflumizon, rinaxipir, lepmectina, piridalilo, fluaciripirim, indoxacarb, bromopropilato, triazamato, fenazaquina, fenpiroximato, piridabeno, tebufenpirad, clofentezina, etoxazol, hexitiazox, pimetrozina, buprofezina, 1,3-dicloropropeno (1,3D), isocarbofos, N-metiliditiocarbamato de amonio (NCS), azociclotina, endosulfan, clordano, cloropiricrina, cihexatina, espinosad, dimetiliditiocarbamato de sodio, óxido de fenbutatina, flusulfamida, isotiocainato de metilo (MITC), rotenona, CL900167, flururo de aluminio y sodio, pirfluquinazon, RU-15525, XDE-175, ZXI-8901 y 15 similares.

Ejemplos de protectores conocidos que se pueden mezclar o que se pueden usar en combinación, se listan a continuación.

Se pueden incluir benoxacor, furilazol, diclormid, diclonona, DKA-24 (N1, N2-dialil-N2-dicloroacetilglicinamida), AD- 67 (4-dicloroacetil-1-oxa-4-azaspiro[4,5]decano), PPG-1292 (2,2-dicloro-N-(1,3-dioxan-2-ilmetil)-N-(2-propenil)acetamida), R-29148 (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina), cloquintcet-mexilo, anhídrido 1,6-naftálico, mefenpir-dimetilo, mefenpir, fenclorazol-etilo, fenclorim, MG-191 (2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxano), ciomeitrinilo, furazol, fluxofenim, isoxaifeno-etilo, mecoprop, MCPA, daimuron, 2,4-D, isoxadifeno, MON4660, oxabetrinilo, cipsosulfamida y similares.

La proporción de incorporación del ingrediente activo en el herbicida de la presente invención se escoge de forma apropiada de acuerdo con la necesidad, y se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 10 % en peso, y preferentemente de 0,05 a 5 % en peso, en el caso de una formulación en forma de polvo o de una formulación en forma de gránulos. La proporción de la incorporación se puede escoger de forma apropiada en el intervalo de 1 a 50 % en peso, y preferentemente de 5 a 30 % en peso, en el caso de una emulsión o una 30 formulación en forma de polvo humectable. La proporción de incorporación se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 1 a 40 % en peso y preferentemente de 5 a 30 % en peso, en el caso de una formulación que fluye y similares.

La cantidad de aplicación del herbicida de la presente invención puede variar dependiendo del tipo de compuesto usado, las malas hierbas objeto de tratamiento, la tendencia de aparición, las condiciones ambientales, la 35 formulación usada y similares, pero en el caso de usar herbicida directamente tal como en forma de una formulación de polvo o una formulación de gránulo como tal, la cantidad de aplicación se puede escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 1 a 50 kg, y preferentemente de 10 g a 10 kg, por una hectárea en términos de ingrediente activo. En el caso de usar el herbicida en estado líquido tal como en forma de concentrado apto para emulsión, una formulación en forma de polvo humectable de una formulación que puede fluir, la cantidad de aplicación se puede 40 escoger de forma apropiada dentro del intervalo de 0,1 a 50000 ppm, y preferentemente de 10 a 10000 ppm.

El herbicida de la presente invención se puede usar a través de aplicación foliar, aplicación al suelo o aplicación sumergida, en terrenos elevados, arrozales, huertos y similares. El herbicida de la presente invención también se puede usar con el fin de controlar las malas hierbas en general en barbechos, caballones entre arrozales, caminos de explotación, diques de drenaje, pastos de recuperación, zonas de enterramiento, parques, calles, zonas de recreo, 45 solares en torno a edificios, zonas de explotación, zonas de estacionamiento, bosques y similares.

El herbicida de la presente invención exhibe excelentes efectos herbicidas sobre un amplio intervalo desde la pre-emergencia hasta el período de crecimiento de las malas hierbas incluyendo, por ejemplo, *Persicaria* spp, tal como *Polygonum lapathifolium* L., *Polygonum longisetum* DeBruyn y *Rumex japonicus* Houtt; *Amaranthus* spp tal como *Amaranthus viridis* L., *Amaranthus palmeri* S. Wats y *Amaranthus retroflexus* L.; malas hierbas de hoja ancha tal como *Solanum carolinense* L., *Solanum nigrum* L., *Chenopodium album* L., *Abutilon theophrasti* medicus, *Sida spinosa* L., *Sesbania exaltata* Cory, *Ambrosia elatior* L., *Papaver rhoeas* L., *Ipomoea* spp., *Xanthium strumarium* L., *Stellaria media* Villars, *Matricaria chamomilla* L., *Galium spurium* L. var. *achinospermon* Hayek, *Viola mandshurica*, *Veronica persica* Poiret, *Veronica hederifolia* L., *Lamium amplexicaule* L., *Vicia angustifolia* L., *Senecio vulgaris* L. y *Capsella Bursa-pastoris* (L.) Medik; malas hierbas cupresáceas anuales o perennes tales como *Cyperus rotundus* L., *Cyperus esculentus* L., *Cyperus brevifolius* Hassk. val. *leiolepis* T. Kovama, *Cyperus microiria* Steud. y *Cyperus iria*; y malas hierbas de gramíneas tales como *Echinochloa esculenta* (A. Braun) H. Scholz, *Digitaria ciliaris* (Retz.) Koel, *Setaria viridis* (L.) P. Beauv. *Poa annua* L., *Alopecurus aequalis* Sobol. var. *amurensis* Ohwi, *Sorghum halepense* Pers., *Alopecurus myosuroides* Huds., *Lolium multiflorum* Lamarck y *Avena sativa* L. El herbicida de la presente invención también puede controlar las malas hierbas anuales que crecen en arrozales, tales como *Echinochloa oryzicola* Vasing, *Echinochloa crus-galli* (L.), P. Beauv. var. *crus-galli*, *Cyperus difformis* L., *Leptochloa chinensis* (L.) Nees, 60 *Monochoria vaginalis* (Burm. f.) Presl. var. *plantaginea* (Roxb.) Solms-Laub., *Lindernia dubia* (L.) Pennell, *Lindernia*

procumbens (Krock.) Philcox., *Rotala indica* (Willd.) Koehne var. *uliginosa* (Miq.) Koehne, *Vandellia angustifolia* Benth., *Limnophila sessiliflora*, *Ammannia multiflora* Roxb., *Elatine triandra* Schk. var. *pedicellata* Krylov., *Monochoria korsakowii* Regel et Maack, *Ludwigia prostrata* Roxb., *Eclipta prostrata* L., *Bidens frondosa* L., *Aeschynomene indica* L. y *Murdannia keisak* Hand-Mazz.; y malas hierbas perennes tales como *Sagittaria pygmaea* Miq., *Sagittaria trifolia* L., *Cyperus serotinus* Rottb., *Eleocharis kuroguwai* Ohwi, *Scirpus juncoides* Roxb., *Alisma canaliculatum* A. Br. et Bouche, *Potamogeton distinctus* A. Bennett, *Leersia japonica* Makino, *Paspalum distichum* L., *Leersia orizoides* (L.) Swartz y *Eleocharis acicularis* Roem. et Schultt var. *longiseta* Svenson.

Además, el herbicida de la presente invención es altamente seguro para plantas útiles y cultivos de utilidad, y exhibe una elevada seguridad para, por ejemplo, cultivos tales como arroz, trigo, cebada, avena común, panizo, mijo, maíz y sorgo en grano; soja, algodón, remolacha azucarera, caña de azúcar, cebolla, girasol, aceite de colza, cacahuete, lino, tabaco, café, patata dulce, patata, tomate y otras hortalizas o césped y similares.

Los cultivos útiles y las plantas útiles usadas en el presente documento incluyen los denominados cultivos modificados genéticamente y cultivos que han sido transformados por medio de tecnologías de ingeniería genética con el fin de exhibir resistencia a herbicidas, plagas y enfermedades similares, tales como maíz, soja, algodón, colza y caña de azúcar; y plantas que exhiben resistencia a herbicidas, plagas, enfermedades y similares a través de exploración.

En lo sucesivo, el procedimiento de producción del compuesto de fórmula [I] de acuerdo con la presente invención, los ejemplos de preparación y los usos se ilustran con detalla por medio de los siguiente Ejemplos, pero no deben interpretarse como limitantes del mismo.

Además, en la siguiente descripción, "%" representa el porcentaje en peso, y "partes" representa partes en peso.

Ejemplo 1

Producción de 3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-metilquinoxalin-2-(1H)-ona (Compuesto N°. I-2 de la invención (véase Tabla 1)).

(1) Producción de 3-oxo-1-ciclohexenil 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato

Se disolvieron 4,6 g (22,5 mmol) de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en diclorometano (200 ml) y se añadieron sobre el mismo N,N-dimetilformamida (0,5 ml) y 4,3 g (33,9 mmol) de cloruro de oxalilo. Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida, y se disolvió el residuo obtenido en diclorometano (100 ml). Se añadió gota a gota la solución a temperatura ambiente a una solución preparada disolviendo 2,8 g (25,0 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 2,7 g (26,7 mmol) de trietilamina en diclorometano (100 ml). Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente y posteriormente, se lavó la mezcla de reacción con agua y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. Se separó la materia inorgánica por medio de filtración, y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida, para obtener 6,3 g (rendimiento de 94 %) de 3-oxo-1-ciclohexenil-1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato en forma de sólido de color amarillo.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,11-2,18 (2H, m), 2,46-2,49 (2H, m), 2,76-2,78 (2H, m), 3,77 (3H, s), 6,13 (1H, s), 7,39-7,47 (2H, m), 7,73 (1H, t), 8,00 (1H, d).

(2) Producción de 3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-metilquinoxalin-2(1H)-ona

Se disolvieron 6,3 g (21,1 mmol) de 3-oxo-1-ciclohexenil-1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato en diclorometano (100 ml) y se añadieron a esta solución 2,4 g (23,7 mmol) de trietilamina y cianohidrina de acetona (1 ml). Se agitó la mezcla durante un día a temperatura ambiente. Se lavó la mezcla de reacción con ácido clorhídrico de 10 % y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se recristalizó el residuo a partir de metanol, para obtener 4,3 g (rendimiento, 68 %) de 3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-metilquinoxalin-2-(1H)-ona en forma de polvo de color blanco (punto de fusión de 191 a 192 °C)

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,05-2,12 (2H, m), 2,45-2,47 (2H, m), 2,76-2,80 (2H, m), 3,71 (3H, s), 7,13-7,38 (2H, m), 7,60 (1H, t), 7,85 (1H, d), 16,3 (1H, s).

Ejemplo 2

Producción de 2-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-fenil-pirido-[2,3-b]pirazin-3 (4H)-ona (Compuesto N°. IV-1 de la invención (véase Tabla 38)).

Se disolvieron 6,50 g (24 mmol) de ácido 3-oxo-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico en diclorometano (100 ml) y se añadieron de forma secuencial sobre esta solución N,N-dimetilformamida (0,5 ml) y 3,8 g (30 mmol) de cloruro de oxalilo. Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido en diclorometano (30 ml) y se

añadió esta solución gota a gota a 0 °C durante 5 minutos a una solución preparada disolviendo 2,7 g (24 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 2,5 g (24 mmol) de trietilamina en diclorometano (30 ml). Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas, y posteriormente se añadieron sobre la misma cianohidrina de acetona (1 ml) y 2,5 g (24 mmol) de trietilamina. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se añadió agua (50 ml) a la solución de reacción, se ajustó la solución de reacción hasta pH 12 usando una solución acuosa de 10 % de hidróxido de sodio y se separó la solución de reacción. Se ajustó la fase acuosa hasta pH 1 añadiendo ácido clorhídrico 6 N y posteriormente se sometió a extracción la fase acuosa con diclorometano. Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro, y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con metanol, para obtener 6,5 g (rendimiento de 73 %) de 2-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-fenil-pirido-[2,3-b]pirazin-3 (4H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,06 (2H, t), 2,44 (2H, s), 2,77 (2H, t), 7,30 (3H, d), 7,53 (3H, m), 8,18 (1H, m), 16,10 (1H, s).

Ejemplo 3

15 Producción de 2-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-4-(4-metoxifenil)-pirido-[2,3-b]pirazin-3 (4H)-ona (Compuesto N°. IV-62 de la invención (véase Tabla 39)).

Se disolvieron 4,4 g (15 mmol) de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico en diclorometano (100 ml) y se añadieron de forma secuencial sobre esta solución N,N-dimetilformamida (0,5 ml) y 3,8 g (30 mmol) de cloruro de oxalilo. Se calentó la mezcla a reflujo durante 1 hora al tiempo que se agitaba. Tras confirmar que la reacción fue completa, se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se destiló el disolvente a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido de este modo en diclorometano (30 ml) y se añadió esta solución gota a gota a 0 °C durante 5 minutos a una solución preparada disolviendo 1,8 g (16 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 1,8 g (18 mmol) de trietilamina en diclorometano (30 ml). Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas, y posteriormente se añadieron sobre la misma cianohidrina de acetona (1 ml) y 1,8 g (18 mmol) de trietilamina. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se añadió agua (20 ml) a la solución de reacción, se ajustó la solución de reacción hasta pH 12 usando una solución acuosa de 10 % de hidróxido de sodio y se separó la solución de reacción. Se ajustó la fase acuosa hasta pH 1 añadiendo ácido clorhídrico 6 N y posteriormente se sometió a extracción la fase acuosa con diclorometano. Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro, y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con metanol, para obtener 4,5 g (rendimiento de 73 %) de 2-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-4-(4-metoxifenil)-pirido-[2,3-b]pirazin-3 (4H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,06 (2H, t), 2,44 (2H, s), 2,77 (2H, t), 3,86 (3H, s), 7,07 (2H, d), 7,28 (2H, d), 8,17 (1H, d), 8,49 (1H, d).

35 Ejemplo 4

Producción de 3-hidroxi-2-(1-metil-2-tioxo-1,2-dihidroquinoxalin-2-il-carbonil)-2-ciclohexen-1-ona (Compuesto N°. I-256 de la invención (véase Tabla 11)).

Se disolvieron 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato y 4,2 g (10,4 mmol) de reactivo de Lawesson a tolueno (50 ml) y se agitó la mezcla durante un día manteniendo la temperatura del líquido en 100 °C. Se enfrió la mezcla de reacción y posteriormente se disolvió el disolvente a presión reducida. Se añadió cloroformo al residuo, se separó la parte insoluble mediante filtración y se concentró el filtrado a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido de este modo en etanol (300 ml), se añadieron 4,9 g de solución acuosa de 25 % de hidróxido de sodio a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla durante un día a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida, se añadió agua a la misma, y se ajustó la mezcla hasta pH 1 usando ácido clorhídrico de 10 %. Se recogió a partir de la misma un precipitado de color blanco mediante filtración, y se lavó con agua. Se secó el sólido obtenido de este modo y se disolvió este sólido en cloroformo (50 ml). Se añadieron 1,7 g (13,4 mmol) de cloruro de oxalilo y una gota de N,N-dimetilformamida a la solución, y se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido de este modo en cloroformo (20 ml). Se añadieron a la misma 0,84 g (7,49 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 0,83 g (8,20 mmol) de trietilamina, y se agitó la mezcla durante una hora a temperatura ambiente. Se añadieron posteriormente 0,83 g (8,20 mmol) de trietilamina y 0,64 g (7,52 mmol) de cianohidrina de acetona a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla durante dos días a temperatura ambiente. Se lavó la mezcla de reacción con ácido clorhídrico de 10 % y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se destiló el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo /cloroformo = 1/1). Se lavó el sólido resultante con acetato de etilo, para obtener 0,40 g de 3-hidroxi-2-(1-metil-2-tioxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carbonil)-2-ciclohexen-1-ona en forma de polvo de color amarillo (punto de fusión de 300 °C o por encima).

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,01-2,11 (2H, m), 2,38-2,44 (2H, m), 2,75-2,81 (2H, m), 4,19 (3H, s), 7,44 (1H, t), 7,55 (1H, d), 7,68 (1H, t), 7,88 (1H, d), 16,3 (1H, s).

Ejemplo 5

5 Producción de 5-fluoro-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2-(1H)-ona (Compuesto N°. II-186 de la invención (véase Tabla 24)).

Se disolvieron 11,1 g (35 mmol) de ácido 5-fluoro-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en cloroformo (300 ml) y se añadieron de forma secuencial sobre esta solución N,N-dimetilformamida (0,5 ml) y 6,7 g (53 mmol) de cloruro de oxalilo. Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido de este modo en cloroformo (100 ml) y se añadió esta solución gota a gota a 0 °C durante 5 minutos a una solución preparada disolviendo 4,4 g (39 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 4,3 g (43 mmol) de trietilamina en cloroformo (200 ml). Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas, y posteriormente se añadieron sobre la misma 1,5 g (18 mmol) de cianohidrina de acetona y 4,3 g (43 mmol) de trietilamina. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Se lavó la solución de reacción con ácido clorhídrico de 10 % y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con metanol, para obtener 13,6 g (rendimiento de 94 %) de 5-fluoro-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2-(1H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,06 (2H, m), 2,43 (2H, a), 2,75 (2H, t), 3,88 (3H, s), 6,57 (1H, d), 7,01-7,10 (3H, m), 7,26-7,35 (3H, m), 16,19 (1H, s).

20 Ejemplo 6

Producción de 5-cloro-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2-(1H)-ona (Compuesto N°. II-194 de la invención (véase Tabla 24)).

Se disolvieron 6,7 g (20 mmol) de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en cloroformo (300 ml) y se añadieron de forma secuencial sobre esta solución N,N-dimetilformamida (0,5 ml) y 5,2 g (41 mmol) de cloruro de oxalilo. Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido de este modo en cloroformo (70 ml) y se añadió esta solución gota a gota a 0 °C durante 5 minutos a una solución preparada disolviendo 2,5 g (22 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 2,5 g (25 mmol) de trietilamina en cloroformo (70 ml). Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas, y posteriormente se añadieron sobre la misma 0,86 g (10 mmol) de cianohidrina de acetona y 2,5 g (25 mmol) de trietilamina. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Se lavó la solución de reacción con ácido clorhídrico de 10 % y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con acetato de etilo, para obtener 6,0 g (rendimiento de 70 %) de 5-cloro-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2-(1H)-ona en forma de polvo de color naranja pálido.

35 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,06 (2H, m), 2,44 (2H, a), 2,75 (2H, t), 3,88 (3H, s), 6,71 (1H, d), 7,09 (2H, d), 7,25-7,30 (3H, m), 7,39 (1H, d), 16,23 (1H, s).

Ejemplo 7

40 Producción de 1-(benzo[d][1,3,dioxol-5-il)-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenecarbonil)-quinoxalin-2-(1H)-ona (Compuesto N°. II-202 de la invención (véase Tabla 9)).

Se disolvieron 5,7 g (19 mmol) de ácido 1-benzo[d][1,3,dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico y 31 g (24 mmol) de cloruro de oxalilo en diclorometano (10 ml) y se añadieron 0,026 g (0,35 mmol) de dimetilformamida sobre los mismos. Se calentó la mezcla a reflujo durante 1 hora al tiempo que se agitaba. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida para obtener cloruro de 1-(benzo[d][1,3,dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carbonilo en forma de cristales de color amarillo (Compuesto N°. de Intermedio de Producción: IX-73).

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

6,12 (2H, d), 6,74-6,76 (2H, m), 6,88 (1H, d), 7,01 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,57 (1H, t), 8,04 (1H, d).

Se disolvió el cloruro de 1-(benzo[d][1,3,dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carbonilo obtenido de este modo en diclorometano (30 ml) y se añadió gota a gota la solución a una mezcla líquida que contenía 2,7 g (24 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona, 3,7 g (36 mmol) de trietilamina y diclorometano (20 ml) bajo enfriamiento con hielo. Tras agitar la solución de reacción durante 3 horas a temperatura ambiente, se añadieron a la mezcla líquida 0,04 g (0,53 mmol) de cianohidrina de acetona y 3,7 g (36 mmol) de solución, y se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Se vertió la solución en agua y se acidificó la fase acuosa con ácido clorhídrico de 10 % y se sometió a extracción con diclorometano. Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó la

materia inorgánica por medio de filtración. Se destiló el disolvente a presión reducida, y se añadió una solución mixta de metanol y agua al residuo obtenido de este modo para obtener un sólido. Se recogió el sólido por filtración y se secó, para obtener 5,5 g (rendimiento de 75 %) de 1-(benzo[d][1,3,dioxol-5-il)-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexen neocarbonil)-quinoxalin-2 (1H)-ona en forma de materia amorfa de color amarillo.

- 5 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):
2,03-2,05 (2H, m), 2,43 (2H, a), 2,73 (2H, t), 6,08 (2H, d), 6,38-6,87 (3H, m), 6,99 (1H, d), 7,29-7,43 (2H, m), 7,88 (1H, d), 16,27 (1H, s).

Ejemplo 8

- 10 Producción de 1-(2,3-dihidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-il)-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexencarbonil)-quinoxalin-2-(1H)-ona (Compuesto N°. I-209 de la invención (véase Tabla 10)).

- Se disolvieron 9,9 g (31 mmol) de ácido 1(2,3-dihidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en diclorometano (100 ml) y se añadieron N,N-dimetilformamida (0,5 ml) y 4,7 g (37 mmol) de cloruro de oxalilo de forma secuencial sobre esta solución. Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida para obtener cloruro de 1-(2,3-dihidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carbonilo en forma de cristales de color amarillo (Compuesto N°. de Intermedio de Producción: IX-75).

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):
4,33 (4H, s), 6,74-6,89 (3H, m), 7,08 (1H, d), 7,44 (1H, t), 7,55 (1H, t), 8,02 (1H, d).

- 20 Se disolvió el cloruro de 1-(2,3-dihidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carbonilo obtenido de este modo en diclorometano (30 ml) y se añadió gota a gota esta solución a 0 °C durante 5 minutos a una solución preparada disolviendo 4,2 g (37 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 6,2 g (61 mmol) de trietilamina y diclorometano (30 ml). Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas, y posteriormente se añadieron sobre la misma cianohidrina de acetona (1 ml) y 6,2 g (61 mmol) de trietilamina. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se añadió agua (50 ml) a la solución de reacción, se ajustó la solución de reacción hasta pH 12 usando una solución acuosa de 10 % de hidróxido de sodio y se separó la solución de reacción. Se ajustó la fase acuosa hasta un pH de 1 añadiendo ácido clorhídrico 6 N y posteriormente se sometió a extracción la fase acuosa con diclorometano. Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro, y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con metanol, para obtener 5,2 g (rendimiento: 40 %) de 1-(2,3-dihidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-il)-3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexencarbonil)-quinoxalin-2-(1H)-ona en forma de cristales de color blanco.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):
2,02-2,09 (2H, m), 2,44 (2H, a), 2,73-2,77 (2H, mt), 4,32 (4H, s), 6,84-6,87 (3H, m), 7,04 (1H, d), 7,28-7,42 (2H, m), 7,87 (1H, d), 16,3 (1H, s).

35 Ejemplo 9

Producción de 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-2-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-pirido[2,3-b]pirazin-3-(4H)-ona (Compuesto N°. IV-222 de la invención (véase Tabla 43)).

- 40 Se disolvieron 24 g (80 mmol) de ácido 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico en cloroformo (180 ml) y se añadieron sobre ello N,N-dimetilformamida (1 ml) y 20 g (160 mmol) de cloruro de oxalilo. Se agitó la mezcla durante 1 hora a 40 °C. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido de este modo en cloroformo (180 ml) y se añadió esta solución gota a gota a 0 °C durante 5 minutos a una solución preparada disolviendo 10 g (90 mmol) de 1,3-ciclohexanodiona y 9,0 g (90 mmol) de trietilamina en cloroformo (180 ml). Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas, y posteriormente se añadieron sobre la misma 0,8 g (10 mmol) de cianohidrina de acetona y 9,0 g (90 mmol) de trietilamina. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente.
- 45 Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida y se sometió a extracción el residuo con acetato de etilo. Se añadió una solución acuosa de 10 % de hidróxido de sodio, y se ajustó el pH de la mezcla hasta 12. Posteriormente, se ajustó la fase acuosa obtenida hasta pH 1 añadiendo ácido clorhídrico 6 N y se sometió a extracción la fase acuosa de nuevo con cloroformo. Se añadieron sulfato de magnesio anhidro y florisil al fase orgánica para secar la capa, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con metanol, para obtener 15 g (rendimiento de 48 %) de 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-2-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-pirido[2,3-b]pirazin-3-(4H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):
2,07 (2H, t), 2,35 (2H, d), 2,44 (2H, sa), 2,78 (2H, t), 7,06 (2H, d), 7,29-7,41 (2H, m), 8,18 (1H, dd), 16,06 (H, sa).

55 Ejemplo 10

Producción de 3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(6-metil-2-piridil)quinoxalin-2-(1H)-ona (Compuesto N°. I-173 de la invención (véase Tabla 7)).

(1) Producción de 3-oxo-1-ciclohexenil 1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato

- 5 Se disolvieron 23,3 g de ácido 1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en cloroformo (100 ml) y se añadieron sobre el mismo 21,0 g de cloruro de oxalilo. Se agitó la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente. Se destiló el disolvente a presión reducida y se disolvió el residuo en 100 ml de cloroformo. Se añadieron 10,2 g de 1,3-ciclohexanodiona y 10,1 g de trietilamina, y se agitó la mezcla durante 2 horas a temperatura ambiente. Se vertió la mezcla de reacción en agua, y se sometió a extracción con cloroformo. Se lavó la fase orgánica con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se destiló posteriormente el disolvente a presión reducida para obtener 28,8 g de 3-oxo-1-ciclohexenil 1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,12 (2H, m), 2,46 (2H, t), 2,65 (3H, s), 2,74 (2H, t), 6,11 (1H, s), 6,68 (1H, d), 7,28 (1H, d), 7,51 (3H, m), 7,93 (1H, d), 8,03 (1H, d).

(2) Producción de 3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(6metil-2-piridil)-quinoxalin-2(1H)-ona

- 15 Se disolvieron 28,8 g de 3-oxo-1-ciclohexenil-1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato en 100 ml de acetonitrilo y se añadieron a sobre ello 9,3 g de trietilamina y 7,2 g de cianohidrina de acetona. Se agitó la mezcla durante una hora a 80 °C. Se destiló el disolvente a presión reducida, de disolvió el residuo en cloroformo y se ajustó el pH de la solución por debajo de 14. Se lavó la fase orgánica con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida, para obtener 24,2 g de 3-(2-hidroxi-6-oxo-1-ciclohexenocarbonil)-1-(6metil-2-piridil)-quinoxalin-2(1H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ (ppm)):

2,06 (m, 2H), 2,45 (t, 2H), 2,64 (s, 3H), 2,76 (t, 2H), 6,68 (s, 1H), 7,39 (m, 4H), 7,89 (m, 2H), 16,32 (s, 1H).

Los valores de propiedad de los compuestos obtenidos en los Ejemplos 1 a 10 y los compuestos de la presente invención producidos de la misma forma que en los presentes Ejemplos se presentan en las Tablas 124 a 134.

25 [Tabla 124]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n _D ²⁰)	
I-1	Punto de fusión	84-86
I-2	Punto de fusión	191-192
I-5	Punto de fusión	193-195
I-7	Punto de fusión	155-157
I-12	Punto de fusión	164-165
I-13	Punto de fusión	151-152
I-14	Punto de fusión	172-174
I-15	Tasa de refracción	1,6148
I-18	Punto de fusión	157-159
I-21	Punto de fusión	144-147
I-22	Punto de fusión	125-128
I-30	Punto de fusión	171-172
I-35	Punto de fusión	205-206
I-40	Punto de fusión	190-192
I-49	Punto de fusión	140-141
I-50	Punto de fusión	144-145
I-57	Punto de fusión	201-203
I-58		Medición imposible
I-59	Punto de fusión	1,5663
I-62	Punto de fusión	164-166

(Continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
I-65	Tasa de refracción	1,6070
I-67	Punto de fusión	184-185
I-68	Punto de fusión	151-152
I-69	Punto de fusión	216-218
I-70	Punto de fusión	179-181
I-71	Punto de fusión	203-205
I-72	Punto de fusión	179-181
I-80	Punto de fusión	249-251
I-81	Punto de fusión	272-274
I-82	Punto de fusión	226-228
I-88	Punto de fusión	142-144
I-90	Punto de fusión	153-155
I-91	Punto de fusión	148-149
I-92	Punto de fusión	218-222
I-93		Oleoso
I-94	Punto de fusión	186-187
I-99	Punto de fusión	187-189
I-100	Punto de fusión	217-219
I-101	Punto de fusión	239-241
I-102	Punto de fusión	181-183
I-103	Punto de fusión	184-186
I-107	Punto de fusión	181-183
I-111	Punto de fusión	214-216
I-112	Punto de fusión	192-194
I-113	Punto de fusión	195-196
I-120	Punto de fusión	215-218
I-125	Punto de fusión	203-204
I-126	Punto de fusión	207-210
I-128	Punto de fusión	233-235

[Tabla 125]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
I-131	Punto de fusión	207-208
I-136	Punto de fusión	178-181
I-137	Punto de fusión	126-127
I-139	Punto de fusión	189-192

ES 2 389 320 T3

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
I-144	Punto de fusión 171-174
I-145	Punto de fusión 87-88
I-148	Punto de fusión 207-208
I-149	Punto de fusión 73-75
I-156	Punto de fusión 105-107
I-158	Punto de fusión 133-135
I-159	Punto de fusión Oleoso
I-160	Punto de fusión 168-169
I-163	Punto de fusión 182-183
I-165	Punto de fusión 185-187
I-166	Punto de fusión 99-101
I-167	Punto de fusión 150-153
I-171	Punto de fusión 177-179
I-173	Punto de fusión 177-179
I-176	Punto de fusión 170-171
I-177	Punto de fusión 125-128
I-178	Punto de fusión 115-117
I-179	Punto de fusión 116-118
I-180	Punto de fusión 129-130
I-182	Punto de fusión 208-210
I-185	Punto de fusión 168-170
I-189	Punto de fusión 141-144
I-195	Punto de fusión 237-239
I-197	Punto de fusión 217-219
I-199	Punto de fusión 187-189
I-201	Punto de fusión 156-157
I-202	Punto de fusión 150-151
I-207	Punto de fusión 146-147
I-209	Punto de fusión 246-248
I-211	Punto de fusión 151-153
I-212	Punto de fusión 199-200
I-213	Punto de fusión 172-175
I-220	Punto de fusión 235-237
I-221	Punto de fusión 187-189

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
I-223	Punto de fusión	213-216
I-225	Punto de fusión	225-228
I-227	Punto de fusión	205-207
I-229	Punto de fusión	162-163
I-230	Punto de fusión	161-164
I-238	Punto de fusión	179-181
I-241	Punto de fusión	161-164
I-243	Punto de fusión	170-171
I-245	Punto de fusión	229-231
I-247	Punto de fusión	233-235
I-249	Punto de fusión	225-226
I-250	Punto de fusión	195-197
I-256	Punto de fusión	300 o más
I-263	Punto de fusión	148-150

[Tabla 126]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
I-2G4	Punto de fusión	170-173
I-2G5	Punto de fusión	193-195
I-266	Punto de fusión	199-200
I-267	Punto de fusión	163-166
I-268	Punto de fusión	127-129
I-269	Punto de fusión	211-213
I-270	Punto de fusión	167-169
I-271	Punto de fusión	138-140
I-272	Punto de fusión	173-174
I-273	Punto de fusión	141-143
I-274	Punto de fusión	148-150
I-275	Punto de fusión	204-205
I-276	Punto de fusión	Medición imposible
I-277	Punto de fusión	135-137
I-278	Punto de fusión	144-145
I-279	Punto de fusión	166-168

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
I-280	Punto de fusión	186-188
I-281	Punto de fusión	139-141
I-282	Punto de fusión	164-165
I-2B3	Punto de fusión	190-192
I-284	Punto de fusión	160-162
I-3G3	Punto de fusión	250-252
I-364	Punto de fusión	168-170
I-365	Punto de fusión	182-183
I-366	Punto de fusión	212-214
I-367	Punto de fusión	208-210
I-368	Punto de fusión	152-154
I-371	Punto de fusión	189-190
I-372	Punto de fusión	205-207
I-373	Punto de fusión	124-126
I-379	Punto de fusión	208-209
I-380	Punto de fusión	146-147
I-385	Punto de fusión	194-196
I-38B	Punto de fusión	172-175
I-395	Punto de fusión	140-142

[Tabla 127]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
II-1	Punto de fusión	68-71
II-4	Punto de fusión	203-204
II-5	Punto de fusión	180-182
II-6	Punto de fusión	172-174
II-7	Punto de fusión	177-17S
II-8	Punto de fusión	70-72
II-9	Punto de fusión	100-101
II-11	Punto de fusión	202-204
II-13	Punto de fusión	201-202
II-14	Punto de fusión	105-107
II-15	Punto de fusión	176-179

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
II-20	Punto de fusión	93-94
II-21	Punto de fusión	123-126
II-23	Punto de fusión	136-138
II-24	Punto de fusión	101-104
II-29	Punto de fusión	169-171
II-33	Punto de fusión	147-149
II-39	Punto de fusión	125-127
II-44	Punto de fusión	112-114
II-51	Punto de fusión	264-266
II-52	Punto de fusión	201-202
II-57	Punto de fusión	124-125
II-62	Punto de fusión	112-114
II-63	Punto de fusión	175-177
II-64	Punto de fusión	174-176
II-68	Punto de fusión	164-167
II-69	Punto de fusión	88-90
II-71	Punto de fusión	78-80
II-74	Punto de fusión	106-108
II-75	Punto de fusión	173-175
II-81	Punto de fusión	135-136
II-84	Punto de fusión	149-150
II-90	Punto de fusión	103-105
II-95	Punto de fusión	111-113
II-101	Punto de fusión	61-64
II-116	Punto de fusión	93-96
II-121	Punto de fusión	125-128
II-122	Punto de fusión	172-174
II-124	Punto de fusión	91-94
II-125	Punto de fusión	274-277
II-129	Punto de fusión	230-232
II-130	Punto de fusión	96-99
II-131	Punto de fusión	136-137
II-136	Punto de fusión	143 146
II-137	Punto de fusión	107-110

[Tabla 128]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
II-140	Punto de fusión	128-130
II-146	Punto de fusión	111-113
II-149	Punto de fusión	101-103
II-167	Punto de fusión	108-110
II-168	Punto de fusión	122-123
II-169	Punto de fusión	215-216
II-173	Punto de fusión	185-188
II-174	Punto de fusión	98-101
II-175	Punto de fusión	110-112
II-177	Punto de fusión	136-138
II-178	Punto de fusión	113-115
II-179	Punto de fusión	190-193
II-180	Punto de fusión	106-109
II-185	Punto de fusión	124-126
II-186	Punto de fusión	242-245
II-187	Punto de fusión	114-116
II-188	Punto de fusión	136-138
II-189	Punto de fusión	187-189
II-190	Punto de fusión	217-219
II-193	Punto de fusión	173-175
II-194	Punto de fusión	105107
II-195	Punto de fusión	191-193
II-196	Punto de fusión	120-122
II-197	Punto de fusión	205-207
II-205	Punto de fusión	139-142
II-208	Punto de fusión	102-104
II-209	Punto de fusión	109-111
II-210	Punto de fusión	98-100
II-211	Punto de fusión	113-115
II-212	Punto de fusión	126-129
II-213	Punto de fusión	171-172
II-214	Punto de fusión	97-99
II-215	Punto de fusión	116-117

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
II-216	Punto de fusión 181-183
II-217	Punto de fusión 197-199
II-218	Punto de fusión 138-140
II-219	Punto de fusión 183-185
II-220	Punto de fusión 128-130
II-221	Punto de fusión 106-109
II-222	Punto de fusión 91-92
II-223	Punto de fusión 110-111
II-224	Punto de fusión 143-145
II-225	Punto de fusión 135-138
II-226	Punto de fusión 141-143
II-227	Punto de fusión 201-203
II-228	Punto de fusión 182-1S5
II-229	Punto de fusión 145-148

[Tabla 129]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
II-230	Punto de fusión 161-163
II-231	Punto de fusión 154-157
II-232	Punto de fusión 205-208
II-233	Punto de fusión 212-214
II-234	Punto de fusión 118-121
II-235	Punto de fusión 97-98
II-236	Punto de fusión 232-234
II-237	Punto de fusión 182-183
II-238	Punto de fusión 213-216
II-239	Punto de fusión 153-155
II-240	Punto de fusión 135137
II-241	Punto de fusión 121-123
II-242	Punto de fusión 145-146
II-243	Punto de fusión 176-179
II-244	Punto de fusión 257-260
II-245	Punto de fusión 165-166

ES 2 389 320 T3

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n _D ²⁰)	
II-246	Punto de fusión	155-155
II-247	Punto de fusión	201-204
II-248	Punto de fusión	113-116
II-249	Punto de fusión	165-167
II-250	Punto de fusión	197-198
II-251	Punto de fusión	129-131
II-252	Punto de fusión	162-164
II-253	Punto de fusión	202-204
II-254	Punto de fusión	104-106
II-255	Punto de fusión	118-120
II-256	Punto de fusión	189-190
II-257	Punto de fusión	91-92
II-258	Punto de fusión	195-197
II-259	Punto de fusión	214-216
II-260	Punto de fusión	224-226
II-261	Punto de fusión	181-183
II-262	Punto de fusión	264 267
II-263	Punto de fusión	194-196
II-301	Punto de fusión	222-223
II-302	Punto de fusión	190-192
II-303	Punto de fusión	102-103
II-304	Punto de fusión	183-185
II-305	Punto de fusión	93-95
II-306	Punto de fusión	156-157
II-307	Punto de fusión	227-229
II-317	Punto de fusión	107-109
II-323	Punto de fusión	106-108

[Tabla 130]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
III-2	Punto de fusión	177-180
III-5	Punto de fusión	101-103
III 7	Punto de fusión	105-106
III-12	Tasa de refracción	1,6862
III-13	Punto de fusión	124-126
III-15	Tasa de refracción	1,5521
III-30	Punto de fusión	128-130
III-35	Punto de fusión	198-200
III-40	Punto de fusión	163-165
III-45	Punto de fusión	141-142
III-59	Punto de fusión	87-88
III-70	Punto de fusión	158-159
III-88	Punto de fusión	119-121
III-90	Punto de fusión	126-128
III-96	Punto de fusión	132-134
III-99	Punto de fusión	142-144
III-107	Punto de fusión	178-180
III-108	Punto de fusión	155-157
III-111	Punto de fusión	170-172
III-117	Punto de fusión	185-188
III-118	Punto de fusión	149-151
III-120	Punto de fusión	167-168
III-130	Punto de fusión	184-185
III-139	Punto de fusión	226-229
III-158	Punto de fusión	185-187
III-173	Punto de fusión	202-204
III-189	Punto de fusión	196-198
III-201	Punto de fusión	135-138
III-202	Punto de fusión	197-199
III-207	Punto de fusión	201-203
III-209	Punto de fusión	231-233
III-212	Punto de fusión	93-96
III-213	Punto de fusión	139-141

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
III-220	Punto de fusión	148-151
III-221	Punto de fusión	182-185
III-229	Punto de fusión	87-88
III-230	Punto de fusión	113-115
III-231	Punto de fusión	143-144
III-232	Punto de fusión	108-110
III-233	Punto de fusión	83-85
III-234	Punto de fusión	168-170
III-235	Punto de fusión	136-138
III-236	Punto de fusión	168-171
III-237	Punto de fusión	128-130
III-238	Punto de fusión	136-137
III-239	Punto de fusión	122-124
III-240	Punto de fusión	222-224

[Tabla 131]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
III-241	Punto de fusión	159-160
III-242	Punto de fusión	71-73
III-243	Punto de fusión	88-89
III-244	Punto de fusión	178-180
III-245	Punto de fusión	161-162
III-246	Punto de fusión	129-131
III-247	Punto de fusión	133-134

5

[Tabla 132]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
IV-1	Punto de fusión	253-255
IV-2	Punto de fusión	158-159
IV-3	Punto de fusión	216-218
IV-4	Punto de fusión	224-226
IV-6	Punto de fusión	216-217
IV-7	Punto de fusión	231-232

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
IV-8	Punto de fusión 181-183
IV-9	Punto de fusión 181-183
IV-11	Punto de fusión 224-227
IV-13	Punto de fusión 203-206
IV-17	Punto de fusión 264-266
IV-18	Punto de fusión 237-230
IV-19	Punto de fusión 261-253
IV-20	Punto de fusión 163-165
IV-21	Punto de fusión 203-205
IV-23	Punto de fusión 110-112
IV-24	Punto de fusión 117-119
IV-30	Punto de fusión 123-125
IV-33	Punto de fusión 198-199
IV-34	Punto de fusión 183-185
IV-39	Punto de fusión 168-171
IV-40	Punto de fusión 176-178
IV-41	Punto de fusión 203-205
IV-44	Punto de fusión 94-96
IV-52	Punto de fusión 171-172
IV-57	Punto de fusión 177-180
IV-62	Punto de fusión 133-135
IV-68	Punto de fusión Medición imposible
IV-69	Punto de fusión 102-104
IV-85	Punto de fusión 185-186
IV-90	Punto de fusión 172-174
IV-95	Punto de fusión 133-136
IV-100	Punto de fusión 100-102
IV-101	Punto de fusión 155-156
IV-106	Punto de fusión 166-169
IV-128	Punto de fusión 176-178
IV-136	Punto de fusión 196-197
IV-150	Punto de fusión 201-202

ES 2 389 320 T3

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
IV-151	Punto de fusión 177-178
IV-152	Punto de fusión 230-232
IV-153	Punto de fusión 242-245
IV-154	Punto de fusión 226-228
IV-155	Punto de fusión 260-261
IV-156	Punto de fusión 215-217
IV-157	Punto de fusión 121-124

[Tabla 133]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
IV-158	Punto de fusión 251-253
IV159	Punto de fusión 183-185
IV-160	Punto de fusión 208-211
IV-161	Punto de fusión 237-240
IV-165	Punto de fusión 228-231
IV-166	Punto de fusión 196-199
IV-168	Punto de fusión 199-201
IV-169	Punto de fusión 171-173
IV-170	Punto de fusión 216-217
IV-173	Punto de fusión 208-210
IV-1V4	Punto de fusión 196-197
IV-177	Punto de fusión 204-207
IV-178	Punto de fusión 167-169
IV-179	Punto de fusión 153-155
IV-180	Punto de fusión 177-179
IV-184	Punto de fusión 181-182
IV-185	Punto de fusión 104-106
IV-186	Punto de fusión 221-223
IV-187	Punto de fusión 214-216
IV-18S	Punto de fusión 217-219
IV-189	Punto de fusión 194-196
IV-191	Punto de fusión 118-120

ES 2 389 320 T3

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})
IV-200	Punto de fusión 237-239
IV-201	Punto de fusión 167-168
IV-202	Punto de fusión 155-157
IV-203	Punto de fusión 189-191
IV-206	Punto de fusión 122-125
IV-208	Punto de fusión 171-172
IV-209	Punto de fusión 242-245
IV-210	Punto de fusión 222-224
IV-211	Medición imposible
IV-212	Punto de fusión 208-210
IV-213	Punto de fusión 177-179
IV-214	Punto de fusión 219-222
IV-215	Punto de fusión 176-178
IV-216	Punto de fusión 118-122
IV-217	Punto de fusión 231-232
IV-218	Punto de fusión 180-182
IV-219	Punto de fusión 200-202
IV-220	Punto de fusión 225-228
IV-221	Punto de fusión 185-187
IV-222	Punto de fusión 185-186
IV-223	Punto de fusión 210-212
IV-224	Punto de fusión 254-257
IV-225	Punto de fusión 167-169
IV-226	Punto de fusión 186-189
IV-227	Punto de fusión 200-202
IV-228	Punto de fusión 182-184
IV-229	Punto de fusión 177-178
IV-230	Punto de fusión 142-144

[Tabla 134]

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
IV-231	Punto de fusión	262-265
IV-232	Punto de fusión	181-183
IV-233	Punto de fusión	200-203
IV-234	Punto de fusión	125-127
IV-235	Punto de fusión	88-89
IV-236	Punto de fusión	170-172
IV-237	Punto de fusión	179-182
IV-238	Punto de fusión	146-149
IV-239	Punto de fusión	207-209
IV-240	Punto de fusión	135-137
IV-241	Punto de fusión	208-211
IV-242	Punto de fusión	137-139
IV-243	Punto de fusión	128-130
IV-244	Punto de fusión	181-182
IV-245	Punto de fusión	92-94
IV-246	Punto de fusión	198-201
IV-247	Punto de fusión	98-100
IV-248	Punto de fusión	122-124
IV-249	Punto de fusión	104-107
IV-250	Punto de fusión	119-122
IV-251	Punto de fusión	184-187
IV-252	Punto de fusión	119-121
IV-253	Punto de fusión	204-205
IV-254	Punto de fusión	233-235
IV-255	Punto de fusión	247-249
IV-256	Punto de fusión	230-232
IV-257	Punto de fusión	234-236
IV-258	Punto de fusión	191-192
IV-259	Punto de fusión	228-229
IV-260	Punto de fusión	202-204
IV-261	Punto de fusión	126-128
IV-262	Punto de fusión	235-237
IV-263	Punto de fusión	216-218

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de Fusión (°C) o Tasa de refracción (n_D^{20})	
IV-264	Punto de fusión	197-199
IV-265	Punto de fusión	266-268
IV-266	Punto de fusión	210-211
IV-267	Punto de fusión	208-210
IV-268	Punto de fusión	217-219
IV-269	Punto de fusión	207-210
IV-270	Punto de fusión	217-220
IV-271	Punto de fusión	74-76
IV-273	Punto de fusión	268-271
IV-274	Punto de fusión	196-199
IV-284	Punto de fusión	181-183
IV-285	Punto de fusión	100-103
IV-286	Punto de fusión	103-105
IV-287	Punto de fusión	217-219

Datos RMN

5 Para los compuestos Nos. 1-15, 1-58, 1-65, 1-93, 1-159, 1-276, III-12, III-15 y IV-211, los datos de RMN- ^1H (CDCl_3/TMS δ (ppm) valor) se presentan a continuación.

Compuesto N° I-15:

1,02 (3H, t), 1,55 (2H, m), 1,81 (2H, m), 2,07(2H, t), 2,44(2H, s), 2,77(2H, t), 4,27(2H, t), 7,36(2H, m), 7,58(1H, t), 7,86 (1H d), 16,32(1H, s).

Compuesto N° I-58:

10 2,07(2H, s), 2,42(2H,s), 2,77(2H,t), 3,34(3H, s), 3,51(2H, s), 3,78(2H, s), 5,79(2H, s), 7,35(1H, t), 7,64(2H, m), 7,83(1H, d), 16,27(1H s)

Compuesto N° I-65:

1,42-2,09 (4H, m), 2,07 (2H, s), 2,43 (2H, s), 3,01 (2H, s), 3,59-4,05 (5H, m), 5,75 (1H, d), 5,85 (1H, d), 7,36 (1H, t), 7,54-7,65 (2H, m), 7,82 (1H, d), 16,3 (1H, a),

15 Compuesto N° 1-68:

1,41 (3H, t), 2,07 (2H, s), 2,44 (2H, s), 2,77 (2H, t), 4,04 (2H, q), 6,87 (1H, m), 7,02 (1H, d), 7,31 (1H, m), 7,46 (1H, t), 8,18 (1H, d), 8,49 (1H, d), 1,48 (3H, t), 4,13 (2H, q), 7,15 (2H, d), 7,23 (2H, d), 7,56 (1H, m), 8,63 (1H, d), 8,72 (1H, d).

Compuesto N° I-93:

20 2,00-2,08(4H, m), 2,43(2H, a), 2,77(2H, t), 3,36(3H, s), 3,47(2H, t), 4,36(2H, t), 7,34(1H, t), 7,50(1H, d), 7,57(1H, t), 7,86(1H d), 16,33(1H, a).

Compuesto N° I-159:

2,07(2H, t), 2,46(2H, a), 2,78(2H, t), 7,25(1H, s), 7,36(1H, t), 7,46(1H, t), 7,61(1H, d), 7,87(1H, d), 7,89(1H, d), 16,23 (1H, a).

25 Compuesto N° I-276:

2,04(2H, m), 2,42(2H, m), 2,53(2H, m), 3,84(3H, s), 6,52-6,60(2H, m), 7,06-7,59(6H, m), 7,86(1H, d), 18,1(1H, s)

Compuesto N° III-12:

1,06 (3H, s), 1,83 (2H, m), 2,08 (2H, t), 2,44 (2H, s), 2,65 (2H, s), 4,41 (2H, t), 7,27 (1H, d), 8,13 (1H, d), 8,61 (1H, d), 16,13 (1H, s)

5 Compuesto N° III-15:

1,01 (3H, s), 1,52 (2H, m), 1,79 (2H, m), 2,05 (2H, t), 2,45 (2H, s), 2,76 (2H, t), 4,47 (2H, t), 7,28 (1H, d), 8,13 (1H, d), 8,61 (1H, d), 16,16 (1H, s)

Compuesto N° IV-211:

10 2,06(2H, t), 2,45(2H, sa), 2,78(2H, sa), 3,73(6H, s), 6,72(2H, d), 7,25(1H, d), 7,42(1H, t), 8,16(1H, dd), 8,46(1H, dd), 16,11(1H, sa)

Ejemplo de Referencia 1

(Intermedio de Producción) Producción de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: V-2)

(1) Producción de 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

15 Se disolvieron 4,0 g (18,3 mmol) de 2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en N,N-dimetilformamida (100 ml) y se añadieron al mismo, bajo corriente de nitrógeno, 0,81 g (20,3 mmol) de hidruro de sodio de 60 % (oleoso), al tiempo que se mantenía la temperatura del líquido dentro del intervalo de 5°C a 10 °C. Tras agitar la mezcla durante una hora a temperatura ambiente, se añadieron gota a gota 3,9 g (27,5 mmol) de yodometano a la solución de reacción. Se agitó la mezcla durante un día a temperatura ambiente, y posteriormente se vertió la mezcla de
20 reacción en agua y se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. Se separó la materia inorgánica por medio de filtración, y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo:hexano = 3:2), para obtener 3,0 g (rendimiento de 71 %) de 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color blanco.
25

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(pp.)):

1,45(3H,t), 3,74(3H,s), 4,51(2H,q), 7,35-7,43(2H,m), 7,67(1H,t), 7,96(1H,d)

(2) Producción de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

30 Se disolvieron 3,0 g (12,9 mmol) de 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato en etanol (100 ml) y se añadieron al mismo gota a gota 4,1 g (25,6 mmol) de una solución acuosa de 25 % de hidróxido de sodio a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla durante un día a temperatura ambiente, y posteriormente se concentró a presión reducida. Se añadió agua a la mezcla de reacción, y se acidificó la solución usando ácido clorhídrico de 10 % y se sometió a extracción con cloroformo. Se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y posteriormente se separó la materia inorgánica por medio de filtración. Posteriormente, se destiló el disolvente a
35 presión reducida, para obtener 2,6 g (rendimiento de 99 %) de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en forma de polvo de color amarillo lechoso.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,89(3H,s), 7,52(1H,d), 7,58(1H,t), 7,86(1H,t), 8,28(1H,d), 14,23(1H,a)

Ejemplo de Referencia 2

40 (Intermedio de Producción) Producción de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: VIII-1)

(1) Producción de 3-oxo-4-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato

45 Se disolvieron 11,68 g (63 mmol) de 3-amino-2-anilino-4-piridina en etanol (150 ml) y se añadieron al mismo 12,07 g (69 mmol) de cetomalonato de dietilo. Se calentó la mezcla a reflujo durante 4 horas al tiempo que se agitaba. Tras confirmar que la reacción fue completa, se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo usando éter diisopropílico, para obtener 10,74 g (rendimiento de 58 %) de 3-oxo-4-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo en forma de cristales de color amarillo pálido.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(pp.)):

50 1,44(3H, t), 4,51 (2H, q), 7,30(2H, d), 7,35(1H, q), 7,56(3H, m), 8,30(1H, q), 8,52(1H q)

(2) Producción de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico

Se disolvieron 10,74 g (36 mmol) de 3-oxo-4-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo en ácido acético (270 ml) y se añadió al mismo ácido clorhídrico 6 N a temperatura ambiente. Posteriormente, se agitó la mezcla durante la noche a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida y se añadió agua (100 ml). El sólido obtenido de este modo se separó mediante filtración y se secó, para obtener 6,50 g (rendimiento de 67 %) de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico en forma de cristales de color marrón claro.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

7,33(2H, d), 7,57(1H, m), 7,65(3H, m), 8,64(1H q), 8,70(1H q)

10 **Ejemplo de Referencia 3**

(Intermedio de Producción) Producción de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: VIII-34)

(1) Producción de N-(4-metoxifenil)-3-nitropiridin-2-amina

Se disolvieron 5,0 g (32 mmol) de 2-cloro-3-nitropiridina en 2-etoxietanol (150 ml) y se añadió al mismo agua (150 ml). Se añadieron a la mezcla de reacción 3,9 g (32 mmol) de 4-metoxianilina y ácido clorhídrico 6 N (1 ml) y se calentó la mezcla a reflujo durante 12 horas al tiempo que se agitaba. Tras Se calentó la mezcla a reflujo durante 4 horas al tiempo que se agitaba. Tras confirmar que la reacción fue completa, se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente, se lavó con salmuera saturada y posteriormente se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro. Se separó la materia inorgánica por medio de filtración, y posteriormente se destiló el disolvente a presión reducida, para obtener 6,6 g (rendimiento de 85 %) de N-(4-metoxifenil)-3-nitropiridin-2-amina en forma de cristales de color naranja.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(pp.)):

3,83(3H, s), 6,78(1H, q), 6,94(2H, d), 7,49(2H, d), 8,44(1H, q), 8,51(1H, q), 9,96(1H, sa)

(2) Producción de 3-amino-2-(4-metoxifenil)-aminopiridina

Se disolvieron 6,6 g (27 mmol) de 3-nitropiridina en metanol (150 ml). Se preparó una solución en la que se disolvió cloruro de estaño (II) dihidratado en ácido clorhídrico 12 N (40 ml) y se añadió esta solución gota a gota a la solución de reacción a 0 °C durante 5 minutos. Se volvió a llevar la solución de reacción hasta temperatura ambiente y posteriormente se agitó durante 3 horas. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida, y se añadió agua (100 ml). Se ajustó el pH de la solución de reacción hasta 12 usando una solución acuosa de 10 % de hidróxido de sodio, posteriormente se filtró y se sometió a extracción con diclorometano. Se secó la fase orgánica obtenida de este modo sobre sulfato de magnesio anhidro, y posteriormente se separó la materia inorgánica por medio de filtración. Se destiló el disolvente a presión reducida, para obtener 5,2 g (rendimiento de 90 %) de 3-amino-2-(4-metoxifenil)-aminopiridina en forma de cristales de color naranja.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,34(2H, s), 3,79(3H, s), 6,06(1H sa), 6,69(1H q), 6,87(2H, d), 6,97(1H q), 7,22(2H, d), 7,80(1H q)

(3) Producción de 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo

Se disolvieron 5,2 g (24 mmol) de 3-amino-2-(4-metoxifenil)aminopiridina en etanol (150 ml) y se añadieron al mismo 4,6 g (27 mmol) de cetomalonato de dietilo. Se calentó la mezcla a reflujo durante 9 horas al tiempo que se agitaba. Tras confirmar que la reacción fue completa, se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se destiló el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía en columna (disolvente de desarrollo: acetato de etilo: hexano = 1:2) para obtener 2,9 g (rendimiento de 37 %) de 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo en forma de cristales de color amarillo.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44(3H, t), 3,88(2H, s), 4,51(2H, q), 7,09(2H, d), 7,22(2H, d), 7,35(1H, q), 8,29(1H, q), 8,54(1H, q).

(4) Producción de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico

Se disolvieron 2,9 g (9 mmol) de 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo en 1,4-dioxano (30 ml). Se preparó una solución en la cual se habían disuelto 1,8 g (13 mmol) de carbonato de potasio en agua (60 ml), y se añadió a la solución de reacción a temperatura ambiente, y posteriormente se agitó la mezcla durante una hora a 50 °C. Tras confirmar que la reacción fue completa, se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se añadió agua (50 ml) y posteriormente se enfrió la solución de reacción hasta 0 °C y se ajustó el pH en 1 usando ácido clorhídrico 6 N. Posteriormente, se separó un sólido por medio de filtración y se secó, para obtener 2,6 g (rendimiento de 98 %) de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico en forma de cristales de color amarillo.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,91 (3H, s), 7,15(2H, d), 7,23(2H, d), 7,56(1H, q), 8,63(1H, q), 8,72(1H, q)

Ejemplo de Referencia 4

(Intermedio de Producción). Producción de 1-(3-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

- 5 Se disolvieron 2,0 g (9,2 mmol) de 2-oxo-1,2-dihidroquinoxalincarboxilato de etilo en diclorometano (100 ml) y se añadieron sobre el mismo 2,8 g de ácido 3-metoxifenilbórico, 3,3 g (1,8 mmol) de acetato de cobre (II) anhidro y 1,4 g (1,8 mmol) de piridina. Se agitó la mezcla durante 72 horas a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se separó la materia inorgánica por medio filtración, se destiló el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de esto modo por medio de cromatografía en columna (disolvente de desarrollo: acetato de etilo: hexano = 1:1) para obtener 1,2 g (rendimiento de 42 %) de 1-(3-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo blanco.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43(3H, t), 3,83(3H, s), 4,51(2H, q), 6,77-6,88(2H, m), 7,08(2H, d), 7,35(1H, t), 7,39-7,53(2H, m), 7,98(1H, d).

Ejemplo de Referencia 5

- 15 (Intermedio de Producción) Producción de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: V-103)

(1) Producción de 2-oxo-1-(2-propinil)-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

- 20 Se disolvieron 9,2 g (62,9 mmol) de N-(2-propinil)-1,2-fenilendiamina y 12,1 g (69,2 mmol) de cetomalonato de dietilo en tolueno (100 ml) y se sometió la solución a reflujo durante 3 horas. Tras confirmar que la reacción fue completa, se concentró la solución de reacción a presión reducida y se lavó la materia sólida obtenida de este modo con éter diisopropílico, para obtener 15,0 g (rendimiento de 93 %) de 2-oxo-1-(2-propinil)-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color blanco

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,45(3H, t), 2,32(1H, t), 4,51(2H, q), 5,08(2H, d), 7,43(1H, t), 7,52(1H, d), 7,70(1H, t), 7,97(1H, d)

- 25 (2) Producción de cloroacetaldioxima

- 30 Se disolvieron 10,4 g (77,9 mmol) de N-clorosuccinimida en N,N-dimetilformamida (65 ml) y se añadieron 3,6 (60,9 mmol) de actaloxima gota a gota a una temperatura dentro del intervalo de 0 °C a 5 °C. Se agitó la mezcla durante 3 horas a 10 °C. Se añadió agua a la solución de la reacción, y se sometió la mezcla a extracción de éter dietílico. Se lavó la fase orgánica con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó y se concentró, para obtener cloroacetaldioxima en forma de líquido de amarillo. Se usó la cloroacetaldioxima obtenida en la reacción posterior sin purificación.

(3) Producción de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo.

- 35 Se disolvieron 3,0 g (11,7 mmol) de 2-oxo-1-(propinil)-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo y 3,28 g (35,1 mmol) de cloroacetaldioxima en tetrahidrofurano (30 ml) y se añadieron gota a gota 3,55 g (35,1 mmol) de trietilamina a una temperatura dentro del intervalo de 0 °C a 5 °C. Se agitó la mezcla durante 3 días a temperatura ambiente. Tras confirmar que la reacción fue completa, se destiló el disolvente a presión reducida, y se sometió a extracción el residuo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una solución acuosa de ácido cítrico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. La materia sólida obtenida de este modo se lavó con éter diisopropílico, para obtener 3,4 g (rendimiento de 93 %) de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color blanco.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,45(3H, t), 2,25(3H, s), 4,52(2H, q), 5,52(2H, s), 6,14(1H, s), 7,42(1H, t), 7,52(1H, d), 7,68(1H, t), 7,98(1H, d)

(4) Producción de ácido 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

- 45 Se disolvieron 3,0 g (9,58 mmol) de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo y 0,46 g (11,5 mmol) de hidróxido de litio monohidratado en una mezcla de disolvente de etanol (30 ml) y agua (30 ml) y se agitó la solución durante 2 horas a temperatura ambiente. Se concentró la solución de reacción hasta la mitad del volumen original, y se añadió agua al residuo. Se acidificó la mezcla usando ácido clorhídrico de 10 %, y posteriormente se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró, para obtener 2,3 g (rendimiento de 84 %) de ácido 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en forma de polvo de color blanco.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,28 (3H, s), 5,66(2H, s), 7,62(1H, t), 7,71(1H, d), 7,87(1H, t), 8,28(1H, d)

Ejemplo de Referencia 6

Producción de ácido 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: V-35)

(1) Producción de 1-(1-metiltiometil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

- 5 Se disolvieron 5,0 g (22,9 mmol) de 2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo, 3,8 g (27,5 mmol) de carbonato de potasio, 4,56 g (27,5 mmol) de yoduro de potasio y 2,43 g (25,2 mmol) de sulfuro de clorometilo y metilo en acetona (100 ml) y se mantuvo la solución a reflujo durante 5 horas. Una vez que se completó la reacción, se destiló el disolvente a presión reducida y se añadió, sobre el residuo obtenido de este modo, una mezcla de agua y acetato de etilo. Se separó la mezcla resultante. Se secó la fase orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó la materia inorgánica por medio de filtración. Se destiló el disolvente a presión reducida y se solidificó el residuo obtenido de este modo usando éter dietílico, para obtener 3,5 g (rendimiento de 55 %) de 1-(1-metiltiometil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color blanco.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44(3H,t), 2,32(3H,s), 4,51(2H,q), 5,39(2H,s), 7,40(2H,m), 7,67(1H,t), 7,98(1H,d)

- 15 (2) Producción de 1-(clorometil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

Se disolvieron 2,1 g (7,5 mmol) de 1-(metiltiometil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en diclorometano (10 ml) y se añadieron gota a gota 1,3 g (9,8 mmol) de cloruro de sulfuro a una temperatura de 10 °C o menos. Se agitó la mezcla durante 2 horas a temperatura ambiente. Tras completar la reacción, se destiló el disolvente a presión reducida, para obtener 1-(clorometil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo. Se usó el producto obtenido de este modo en la reacción posterior sin purificación.

(3) Producción de 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

- 25 Se disolvieron 1,2 g (9,0 mmol) de 2,2,2-trifluoroetanol en N,N-dimetilformamida (20 ml) y se añadieron 0,36 (9,0 mmol) de hidruro de sodio de 60 % (oleoso) en pequeñas proporciones. Se agitó la mezcla durante una hora a temperatura ambiente. Sobre esta solución de reacción, se añadió el 1-(clorometil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo obtenido previamente a una temperatura de 10 °C o menos. Se agitó la mezcla durante 3 horas a temperatura ambiente, y posteriormente se vertió en agua con hielo, y se recogió la materia sólida precipitada a partir de la misma por medio de filtración. Se lavó la materia sólida obtenida de este modo con agua, y posteriormente se secó a presión reducida, para obtener 2,0 g (rendimiento de 81 %) de 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color amarillo.

30 ¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,45(3H, t), 4,10 (2H, q), 4,52 (2H, q), 5,85(2H, s), 7,45(1H, t), 7,54(1H, d), 7,68(1H, t), 7,97(1H, d)

(4) Producción de ácido 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

- 35 Se disolvieron 1,5 g (4,54 mmol) de 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo y 0,28 g (6,81 mmol) de hidróxido de litio monohidratado en una mezcla de disolvente de etanol (30 ml) y agua (30 ml) y se agitó la solución durante 2 horas a temperatura ambiente. Se concentró la solución de reacción hasta la mitad del volumen original y posteriormente se añadió agua al residuo. Se acidificó la mezcla usando ácido clorhídrico de 10 % y posteriormente se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró, para obtener 2,4 g (rendimiento de 53 %) de ácido 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en forma de polvo de color blanco.

40 ¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

4,14 (2H, q), 5,98(2H, s), 7,64(2H, m), 7,86(1H, t), 8,26(1H, d)

Ejemplo de Referencia 7

Producción de ácido 5-fluoro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N° VI-134)

- 45 (1) Producción de 3-fluoro-N-(4-metoxifenil)-2-nitroanilina

Se disolvieron 20,0 g (126 mmol) de 2,6-difluoronitrobenceno y 17,0 g (138 mmol) de p-anisidina en N,N-dimetilformamida (60 ml) y se añadieron al mismo 20,8 g (150 mmol) de carbonato de potasio. Se calentó la mezcla con agitación durante 12 horas a 75 °C. Se vertió la mezcla de reacción en agua y se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua, ácido clorhídrico de 10 %, agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio por este orden, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo:hexano = 1:9) para obtener 21,2 g (rendimiento de 64 %) de 3-fluoro-N-(4-metoxifenil)-2-nitroanilina en forma de un líquido de color marrón.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,84(s, 3H), 6,50(t, 1H), 6,73(d, 1H), 6,94(d, 2H), 7,15-7,21(m, 3H), 8,51(a, 1H)

(2) Producción de 3-fluoro-N¹-(4-metoxifenil)-2-fenilendiamina

5 Se disolvieron 21,2 g (80,8 mmol) de 3-fluoro-N-(4-metoxifenil)-2-nitroanilina en etanol (600 ml) y se añadieron 2,1 g de carbono activado sobre paladio de 5 % sobre el mismo. Se agitó la mezcla durante 12 horas en atmósfera de hidrógeno. Se filtró la mezcla de reacción y se concentró el filtrado a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de hexilo:hexano = 1:4), para obtener 15,4 g (rendimiento de 82 %) de 3-fluoro-N¹-(4-metoxifenil)-1,2-fenilendiamina en forma de líquido de color amarillo claro.

10 ¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,63(br,2H), 3,78(s,3H), 5,12(a, 1H), 6,61-6,83(m,7H)

(3) Producción de 5-fluoro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

15 Se disolvieron 15,4 g (66,3 mmol) de 3-fluoro-N¹-(4-metoxifenil)-1,2-fenilendiamina y 11,6 g (66,6 mmol) de cetomalonato de dietilo en benceno (400 ml) y se calentó la solución a reflujo durante 2 horas al tiempo que se retiraba el agua usando un aparato de Dean-Stark. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida, y posteriormente se disolvió el residuo obtenido de este modo en acetato de etilo, y se lavó con agua, ácido clorhídrico de 10 % y una solución saturada de cloruro de sodio. Se secó la fase orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. Se recristalizó el residuo obtenido de este modo a partir de etanol, para obtener 14,5 g (rendimiento de 64 %) de 5-fluoro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de cristales aciculares de color magenta claro.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43(t,3H), 3,89(s,3H), 4,50(q,2H), 6,56(d,1H), 7,05-7,22(m,5H), 7,39(m, 1H)

(4) Producción de ácido 5-fluoro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

25 Se disolvieron 14,3 g (41,8 mmol) de 5-fluoro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato en etanol (100 ml) y se añadieron al mismo 10,0 g (62,5 mmol) de solución acuosa de 25 % de hidróxido de sodio. Se agitó la mezcla durante 2 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida, y se añadió agua al residuo obtenido de este modo. Se acidificó la mezcla usando ácido clorhídrico de 10 %. Se separó un precipitado sólido a partir del mismo mediante filtración, se lavó con agua y posteriormente se secó, para obtener 11,1 g (rendimiento de 84 %) de ácido 5-fluoro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico.

30 ¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,93(s, 3H), 6,71(d, 1H), 7,15-7,29(m, 5H), 7,60(m, 1H)

Ejemplos de referencia 8

Producción de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°. VI-142)

35 (1) Producción de 3-cloro-1,2-fenilendiamina

40 Se disolvieron 12,5 g (72,4 mmol) de 3-cloro-2-nitroanilina en metanol (250 ml) y se añadió gota a gota una solución preparada disolviendo 57,2 g (253 mmol) de cloruro de estaño (II) dihidratado en ácido clorhídrico concentrado (75 ml). Se calentó la mezcla de reacción con agitación durante 3 horas, y se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo obtenido de este modo y se alcalinizó la solución con una solución acuosa de 25 % de hidróxido de sodio y se sometió a extracción con cloruro de metileno. Se secó la capa orgánica sometida a extracción sobre sulfato de magnesio anhidro, y posteriormente se concentró a presión reducida, para obtener 10,5 g (rendimiento > 99 %) de 3-cloro-1,2-fenilendiamina en forma de líquido de color magenta claro.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,58(a, 4H), 6,60-6,65(m, 2H), 6,82(m, 1H).

45 (2) Producción de 5-cloro-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

50 Se disolvieron 10,5 g (73,6 mmol) de 3-cloro-1,2-fenilendiamina y 12,8 g (73,5 mmol) de cetomalonato de dietilo en etanol y se calentó la solución a reflujo durante 3 horas. Al tiempo que se calentaba a reflujo, se añadió sobre el mismo etanol hasta que se disolvieron los cristales precipitados. Se enfrió la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente, y posteriormente se separaron los cristales precipitados por medio de filtración. Se lavó la torta filtrante con etanol frío, y posteriormente se secó, para obtener 10,5 g (rendimiento de 51 %) de 5-cloro-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de cristales aciculares de color amarillo claro.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44(t,3H), 4,51(q,2H), 7,26-7,46(m,3H), 12,79(a.1H)

(3) Producción de 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

A una suspensión que contenía 5,7 g (22,6 mmol) de 5-cloro-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo, 6,9 g (45,4 mmol) de ácido 4-metoxifenilbórico, 8,2 g (45,1 mmol) de acetato de cobre (II) anhidro y cloroformo (200 ml), se añadieron gota a gota 3,6 g (45,5 mmol) de piridina y 4,6 g (45,5 mmol) de trietilamina, y se agitó la mezcla de reacción durante 72 horas a temperatura ambiente. Se lavó la mezcla de reacción con ácido clorhídrico de 10 %, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. Se aisló el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo, acetato de etilo: hexano = 2:3) y se lavó el sólido aislado con éter diisopropílico, para obtener 6,3 g (rendimiento de 78 %) de 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color amarillo claro.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43(t, 3H), 3,89(s,3H), 4,51(q,2H), 6,69(d, 1H), 7,11(d,2H), 7,18(d,2H), 7,33(t, 1H), 7,44(d, 1H).

(4) Producción de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

Se disolvieron 7,7 g (21,5 mmol) de 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en etanol (100 ml) y se añadieron al mismo 6,9 g (43,1 mmol) de solución acuosa de 25 % de hidróxido de sodio. Se agitó la mezcla durante 12 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla a presión reducida, se añadió agua al residuo obtenido de este modo, y se acidificó la mezcla usando ácido clorhídrico de 10 %. Se separó un sólido precipitado a partir del mismo por medio de filtración, se lavó con agua, y posteriormente se secó, para obtener 6,7 g (rendimiento de 94 %) de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en forma de polvo de color amarillo claro

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,93(s, 3H), 6,82(d, 1H), 7,17(d, 2H), 7,22(d,2H), 7,55(t, 1H), 7,62(d, 1H)

Ejemplo de Referencia 9

Producción de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de intermedio de producción N°. V-155).

(1) Producción de N-(2-nitrofenil)benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina

Se disolvieron 9,3 g (66 mmol) de 2-fluoro-nitrobenceno y se añadieron al mismo 10 g (73 mmol) de benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina en N,N-dimetilformamida (60 ml) y 10,9 (79 mmol) de carbonato de potasio. Se calentó la solución mixta a reflujo durante 10 horas al tiempo que se agitaba. Se vertió la mezcla de reacción en agua, y se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica sometida a extracción con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo mediante cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo:hexano = 1:3), para obtener 11 g (rendimiento de 65 %) de N-(2-nitrofenil)benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina en forma de cristales de color rojo púrpura.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

6,02 (1H, s), 6,76-6,87 (3H, m), 7,23 (1H, d), 7,46 (1H, d), 7,62 (1H, d), 7,99 (1H, d), 8,47 (1H, s)

(2) Producción de N-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)benzen-1,2-diamina

Se disolvieron 13,6 g (244 mmol) de polvo de hierro y 10,5 g (40 mmol) de N-(2-nitrofenil)benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina a una mezcla de disolvente de acetato de etilo (130 ml), agua (65 ml) y ácido acético (15 ml) y se agitó la mezcla durante 1 hora a 70 °C. Se enfrió la mezcla hasta temperatura ambiente y se separó el residuo por medio de filtración usando un coadyuvante de filtración. Se separó la fase orgánica del filtrado, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 9,2 g (rendimiento de 99 %) de N-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)benzen-1,2-diamina en forma de cristales de color blanco.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,2 (2H, sa), 5,02 (1H, sa), 5,89 (2H, s), 6,20-6,24 (1H, m), 6,38-6,39 (1H, m), 6,67 (1H, d), 6,71-6,80 (2H, m), 6,94-7,05 (2H, m)

(3) Producción de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

Se disolvieron 9,2 g (40 mmol) de N-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)benzen-1,2-diamina en tolueno (200 ml) y se añadieron sobre el mismo 8,4 g (48 mmol) de cetomalonato de dietilo. Se calentó la mezcla a reflujo durante 2 horas al tiempo que se retiraba agua usando un aparato de Dean-Stark. Se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente y se destiló el disolvente a presión reducida. Se solidificó el residuo obtenido de este modo usando etanol para obtener 13,6 g (rendimiento de 49 %) de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de cristal de color amarillo.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44 (3H, t), 4,50 (2H, q), 6,09 (2H, d), 6,74-6,77 (2H, m), 6,83 (1H, d), 7,01 (1H, d), 7,36 (1H, t), 7,47 (1H, t), 7,97 (1H, d)

(4) Producción de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

- 5 Se disolvieron 6,7 g (18 mmol) de 1,2-hidroxi-quinoxalin-3-carboxilato y 0,9 g (21 mmol) de hidróxido de litio monohidratado en una mezcla de disolvente de etanol (60 ml) y agua (60 ml) y se agitó la solución durante 2 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida y se añadió agua al residuo obtenido de este modo. Se acidificó la mezcla usando ácido clorhídrico de 10 %. Se separó un precipitado sólido a partir del mismo por medio de filtración, se lavó con agua, y posteriormente se secó para obtener 5,0 g (rendimiento de 93 %) de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en forma de cristales de color amarillo.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

6,15 (2H, s), 6,73 (1H, d), 6,88 (1H, d), 7,05 (1H, s), 7,13 (1H, d), 7,40 (1H, t), 7,52 (1H, t), 7,89 (1H, d).

Ejemplos de Referencia 10

- 15 Producción de ácido 1-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: V-158).

(1) Producción de N-(2-nitrofenil)-2,3-dihidrobenczo[d][1,4]dioxin-6-amina

- 20 Se disolvieron 5,9 g (30 mmol) de 2,3-dihidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-amina y 5,0 g (35 mmol) de 2-fluoronitrobenceno en N-metilpirrolidona (70 ml) y se añadieron 20,8 g (150 ml) de carbonato de potasio al mismo. Se calentó el disolvente con agitación durante 10 horas a 120 °C. Se vertió la mezcla de reacción en agua, y se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua, ácido clorhídrico de 10 %, agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio por este orden, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo:hexano = 1:4) para obtener 6,4 g (rendimiento de 66 %) de N-(2-nitrofenil)-2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-amina en forma de líquido de color rojo.

25 ¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

4,29 (4H, s), 6,70-6,76 (2H, m), 6,81 (1H, d), 6,90 (1H, d), 7,09 (1H, d), 7,33 (1H, t), 8,18 (1H, d), 9,36 (1H, s)

(2) Producción de N-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)bencen-1,2-diamina

- 30 Se calentó una mezcla de 6,3 g (23 mmol) de N-(2-nitrofenil)-2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-amina, 9,0 g (161 mmol) de polvo de hierro, ácido acético (1 ml), agua (35 ml) y tolueno (70 ml) a reflujo durante 8 horas. Se filtró la mezcla de reacción para separar el residuo. Se separó la fase orgánica del filtrado, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 5,1 g (rendimiento de 91 %) de N-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)bencen-1,2-diamina en forma de líquido de color marrón.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,71 (2H, a), 4,18-4,25 (4H, m), 4,97 (1H, a), 6,29-6,32 (2H, m), 6,70-6,79 (3H, m), 6,95 (1H, t), 7,06 (1H, d)

- 35 (3) Producción de 1-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

- 40 Se disolvieron 5,0 g (21 mmol) de N-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)bencen-1,2-diamina y 3,9 g (22 mmol) de cetomalonato de dietilo en tolueno (60 ml) y se calentó la solución a reflujo durante 12 horas al tiempo que se retiraba el agua usando un aparato de Dean-Stark. Se lavó la solución de reacción con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido de este modo por medio de cromatografía de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo: hexano = 2:3) para obtener 4,6 g (rendimiento de 63 %) de 1-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en forma de polvo de color amarillo lechoso.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43 (3H, t), 4,30-4,36 (4H, m), 4,50 (2H, q), 6,74-6,85 (3H, m), 7,06 (1H, d), 7,32-7,49 (2H, m), 7,97 (1H, d)

- 45 (4) Producción de ácido 1-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

- 50 Se disolvieron 4,5 g (13 mmol) de 1-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en etanol (100 ml), y se añadieron sobre el mismo 4,1 g (26 mmol) de una solución acuosa de 25 % de hidróxido de sodio. Se agitó la solución durante 2 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida y se añadió agua al residuo obtenido de este modo. Se acidificó la mezcla usando ácido clorhídrico de 10 %. Se separó un sólido precipitado a partir del mismo por medio de filtración, se lavó con agua, y posteriormente se secó para obtener 3,9 g (rendimiento de 94 %) de ácido 1-(2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico en forma de polvo de color amarillo claro.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

4,35-4,39 (4H, m), 6,77 (1H, d), 6,85 (1H, s), 6,99 (1H, d), 7,14 (1H, d), 7,53-7,67 (2H, m), 8,28 (1H, d)

Ejemplo de Referencia 11

5 Producción de ácido 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3]pirazin-2-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: VIII-164)

(1) Producción de N-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-nitro-2-piridilamina

10 Se disolvieron 45 g (0,28 mmol) de 2-cloro-3-nitropiridina en 2-etoxietanol (300 ml) y se añadieron sobre el mismo 36 g (0,28 mmol) de 3-fluoro-4-metilfenilamina, ácido clorhídrico 12N y agua (300 ml). Se calentó la solución mixta a reflujo durante 24 horas al tiempo que se agitaba. Se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se sometió a extracción la solución con acetato de etilo, y se lavó con salmuera saturada y posteriormente se secó la capa orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro. Se concentró la mezcla a presión reducida, y se lavó el residuo obtenido de este modo con éter diisopropílico para obtener 57 g (rendimiento de 82 %) de N-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-nitro-2-piridilamina.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

15 2,27 (3H, d), 6,85 (1H, q), 7,16 (2H, d), 7,60 (1H, d), 8,50 (1H, m), 8,54 (1H, d), 10,10 (1H, sa).

(2) Producción de N²-(3-fluoro-4-metilfenil)-2,3-piridindiamina

20 Se disolvieron 57 g (0,23 mol) de N-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-nitro-2-piridilamina en acetato de etilo (250 ml) y se añadieron al mismo agua (125 ml) y ácido acético (80 ml) y se calentó la solución hasta 50 °C. Se añadieron 77 g (1,40 mol) de polvo de hierro a la solución de reacción de manera que la temperatura no excediera de 60 °C y posteriormente se agitó durante 1 hora a 60 °C. Se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente, y se separó la materia orgánica por medio de filtración. Se sometió a extracción con acetato de etilo, y se lavó con salmuera saturada y posteriormente se secó la capa orgánica obtenida sobre sulfato de magnesio anhidro. Se destiló el disolvente a presión reducida, y se lavó el residuo obtenido de este modo con hexano para obtener 45 g (rendimiento de 90 %) de N²-(3-fluoro-metilfenil)-2,3-piridindiamina.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

25 2,20 (3H, d), 3,27 (2H, s), 6,26 (1H, sa), 6,74-6,86 (2H, m), 6,98-7,14 (3H, m), 7,83 (1H, dd)

(3) Producción de 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo

30 Se disolvieron 46 g (0,21 mol) de N²-(3-fluoro-4-metilfenil)-2,3-piridindiamina en tolueno (400 ml) y se añadieron al mismo 40 g (0,23 mol) de cetomalonato de dietilo y 92 g de un tamiz molecular 4A. Se calentó la solución a reflujo durante 12 horas al tiempo que se retiraba el agua usando un aparato de Dean-Stark. Se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente, se filtró el material inorgánico y se destiló el disolvente a presión reducida. Se lavó el residuo obtenido de este modo con éter diisopropílico para obtener 50 g (rendimiento de 73 %) de 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

35 1,44 (3H, t), 2,37 (3H, d), 4,52 (2H, q), 7,01 (2H, d), 7,35-7,42 (2H, m), 8,30 (1H, dd), 8,54 (1H, d)

(4) Producción de ácido 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico

40 Se disolvieron 45 g (0,14 mol) de 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxilato de etilo en 1,4 dioxano (300 ml) y se añadió sobre el mismo una solución de 39 g (0,28 mol) de carbonato de potasio y agua (300 ml). Se agitó la solución durante 1 hora a 60 °C. Se enfrió la solución de reacción hasta temperatura ambiente, y se destiló el disolvente a presión reducida. Se añadió agua sobre el residuo obtenido de este modo y se lavó con cloroformo. Posteriormente, se ajustó el pH de la fase acuosa hasta 1 mediante la adición de ácido clorhídrico 6 N, y se sometió a extracción de nuevo la fase acuosa con cloroformo. Se añadió sulfato de magnesio anhidro a la capa orgánica para secarla, y se destiló el disolvente a presión reducida para obtener 32 g (rendimiento de 76 %) de ácido 4-(3-fluoro-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-dihidropirido[2,3-b]pirazin-2-carboxílico.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

45 2,41 (3H, d), 7,04 (2H, d), 7,48 (1H, t), 7,55-7,60 (1H, m), 8,63 (1H, dd), 8,70-8,72 (1H, m)

Ejemplo de Referencia 12

Producción de ácido 1-(6-metilpiridin-2-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico (Compuesto de Intermedio de Producción N°: V-127).

50 (1) Producción de N¹-(difenilmetil)-N²-(6-metilpiridin-2-il)benceno-1,2-diamina

Se disolvieron 37,8 g (0,11 mol) de 2-bromo-N-(difenilmetileno)anilina en tolueno (100 ml) y se añadieron sobre el mismo 14,6 g (0,13 mol) de 2-amino-6-picolina, 5,2 g (5,5 mmol) de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0), 11,2 g (17,6 mmol) de 2,2'-bis(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo y 15,2 g (0,15 mol) de t-butoxido de potasio. Se agitó la mezcla durante 2 horas a 100 °C. Se vertió la mezcla en agua y se sometió a extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se destiló el disolvente a presión reducida y se lavó el residuo con metanol para obtener 42,1 g (rendimiento > 99 %) de N1-(difenilmetileno)-N2-(6-metilpiridin-2-il)bencen-1,2-diamina.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,44 (3H, s), 6,32 (1H, d), 6,64 (3H, m), 6,95 (2H, m), 7,14 (2H, d), 7,25-7,51 (7H, m), 7,75 (2H, d), 7,96 (1H, m)

(2) Producción de N-(6-metilpiridin-2-il)bencen-1,2-diamina

Se disolvieron 42,1 g (0,11 mol) de N¹-(difenilmetileno)-N²-(6-metilpiridin-2-il)bencen-1,2-diamina en tetrahidrofurano (100 ml) y se añadió sobre el mismo ácido clorhídrico de 10 % (45 ml), y se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Se destiló el disolvente a presión reducida y se añadió agua al residuo obtenido de este modo y se lavó con acetato de etilo. Posteriormente, se ajustó el pH de la fase acuosa a pH > 11 y se sometió a extracción la fase acuosa con cloruro de metileno. Se lavó la fase orgánica con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y posteriormente se destiló a presión reducida para obtener 19,8 g (rendimiento de 83 %) de N-(6-metilpiridin-2-il)bencen-1,2-diamina.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,43 (3H, s), 3,86 (2H, s), 5,99 (1H, s), 6,21 (1H, d), 6,57 (1H, d), 6,80 (2H, m), 7,05 (1H, t), 7,16 (1H, d), 7,33 (1H, t)

(3) Producción de 1-(6-metilpiridin-2-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo

Se disolvieron 19,8 g (0,1 mol) de N-(6-metilpiridin-2-il)bencen-1,2-diamina en tolueno (100 ml) y se añadieron sobre el mismo 19,0 g (0,11 mol) de cetomalonato de dietilo y 57,1 g de tamiz molecular 4A. Se calentó la solución a reflujo durante 3 horas al tiempo que se retiraba el agua usando un aparato de Dean-Stark. Se filtró la mezcla de reacción y se concentró el filtrado a presión reducida para obtener 27,2 g (rendimiento de 89 %) de 1-(6-metilpiridin-2-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,42 (3H, t), 2,64 (3H, s), 4,51 (2H, q), 6,65 (1H, d), 7,24 (1H, d), 7,43 (3H, m), 7,90 (1H, t), 8,00 (1H, d)

(4) Producción de ácido 1-(6-metilpiridin-2-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico

Se disolvieron 27,2 g (88 mmol) de 1-(6-metilpiridin-2-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxilato de etilo en 1,4-dioxano (50 ml) y se añadió sobre el mismo agua (50 ml) y 18,3 g (0,13 mol) de carbonato de potasio, y se agitó la solución durante 1 hora a 60 °C. Se destiló el disolvente a presión reducida y se ajustó el pH de la fase acuosa a pH < 4. Se filtraron los cristales precipitados para obtener 23,3 g (rendimiento de 94 %) de ácido 1-(6-metilpiridin-2-il)-2-oxo-1,2-dihidroquinoxalin-3-carboxílico.

¹H-NMR (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,55 (3H, s), 6,57 (1H, d), 7,47 (4H, m), 7,94 (1H, d), 8,07 (1H, t)

Los valores de propiedad de los intermedios de producción obtenidos en los Ejemplos de Referencia anteriores 1 a 12 y los intermedio de producción generados de la misma manera en los presentes Ejemplos de Referencia se presentan en la Tabla 135 a 137.

[Tabla 135]

Compuesto N°.	Punto de fusión (°C) o Tasa de Refracción (n _D ²⁰)
V-2	Punto de fusión 175-176
V-3	Punto de fusión 173-175
V-4	Punto de fusión 165-167
V-5	Punto de fusión 189-190
V-6	Punto de fusión 204-207
V-10	Punto de fusión 253-256
V-37	Punto de fusión 125-127
V-42	Punto de fusión 177-179

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de fusión (°C) o Tasa de Refracción (n_D^{20})	
V-52	Punto de fusión	179-181
V-97	Punto de fusión	171-173
V-102	Punto de fusión	165-167
V-103	Punto de fusión	152-154
V-120	Punto de fusión	191-193
V-121	Punto de fusión	291-293
V-125	Punto de fusión	176-178
V-127	Punto de fusión	185-186
V-130	Punto de fusión	164-166
V-131	Punto de fusión	159-161
V-132	Punto de fusión	156-159
V-133	Punto de fusión	167-169
V-134	Punto de fusión	185-188
V-136	Punto de fusión	173-176
V-139	Punto de fusión	161-163
V-155	Punto de fusión	183-185
V-158	Punto de fusión	197-198
V-164	Punto de fusión	158-160
V-169	Punto de fusión	190-192
V-170	Punto de fusión	175-177
V-172	Punto de fusión	185-186
V-174	Punto de fusión	190-192
V-176	Punto de fusión	204-205
V-178	Punto de fusión	164-166
V-189	Punto de fusión	207-208
V-191	Punto de fusión	209-210
V-193	Punto de fusión	207-209
V-195	Punto de fusión	214-216
V-198	Punto de fusión	181-183

[Tabla 136]

Compuesto N°.	Punto de fusión (°C) o Tasa de Refracción (n_D^{20})	
V-207	Punto de fusión	145-147
V-212	Punto de fusión	187-189
V-213	Punto de fusión	170-172
V-214	Punto de fusión	172-173
V-217	Punto de fusión	210-212
V-221	Punto de fusión	187-188
V-222	Punto de fusión	173-175
V-223	Punto de fusión	167-169
V-224	Punto de fusión	197-199
V-225	Punto de fusión	179-180
V-305	Punto de fusión	170-173
V-306	Punto de fusión	138-140
V-307	Punto de fusión	181-183
V-308	Punto de fusión	202-204
V-311	Punto de fusión	187-188
V-313	Punto de fusión	163-165
V-314	Punto de fusión	140-143
V-315	Punto de fusión	167-169
V-316	Punto de fusión	197-199
V-317	Punto de fusión	180-182
V-318	Punto de fusión	201-208
VI-34	Punto de fusión	173-175
VI-54	Punto de fusión	162-163
VI-77	Punto de fusión	183-185
VI-122	Punto de fusión	176-178
VI-135	Punto de fusión	195-197
VI-136	Punto de fusión	191-192
VI-137	Punto de fusión	165-166
VI-138	Punto de fusión	182-184
VI-141	Punto de fusión	159-161
VI-142	Punto de fusión	198-200
VI-154	Punto de fusión	163-165
VI-156	Punto de fusión	179-180
VI-161	Punto de fusión	182-183

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de fusión (°C) o Tasa de Refracción (n_D^{20})
VI-163	Punto de fusión 196-198
VI-167	Punto de fusión 154-156
VI-170	Punto de fusión 185-187
VI-171	Punto de fusión 208-209
VI-174	Punto de fusión 220-222
VI-175	Punto de fusión 156-159
VI-177	Punto de fusión 200-201
VI-179	Punto de fusión 175-176
VI-180	Punto de fusión 199-200
VI-181	Punto de fusión 174-176
VI-182	Punto de fusión 186-189
VI-184	Punto de fusión 182-184

[Tabla 137]

Compuesto N°.	Punto de fusión (°C) o Tasa de Refracción (n_D^{20})
VI-187	Punto de fusión 192-193
VI-188	Punto de fusión 186-187
VI-190	Punto de fusión 193-194
VI-191	Punto de fusión >300
VI-192	Punto de fusión 99-101
VI-193	Punto de fusión 177-180
VI-194	Punto de fusión 177-178
VI-196	Punto de fusión 166-168
VI-197	Punto de fusión 184-186
VI-199	Punto de fusión 164-165
VI-200	Punto de fusión 200-201
VI-201	Punto de fusión 192-195
VI-239	Punto de fusión 195-196
VI-240	Punto de fusión 155-157
VI-241	Punto de fusión 141-143
VI-244	Punto de fusión 215-217
VI-245	Punto de fusión 183-184
VI-246	Punto de fusión 197-198
VI-247	Punto de fusión 198-200

(continuación)

Compuesto N°.	Punto de fusión (°C) o Tasa de Refracción (n _D ²⁰)
VII-3	Punto de fusión 143-144
VII-4	Punto de fusión 144-147
VII-5	Punto de fusión 157-158
VII-7	Punto de fusión 119-120
VII-8	Punto de fusión 140-141
VII-61	Punto de fusión 127-129
VII-78	Punto de fusión 131-132
VII-79	Punto de fusión 159-160
VII-82	Punto de fusión 162-165
VII-8B	Punto de fusión 182-184
VII-89	Punto de fusión 176-178
VII-126	Punto de fusión 232-235
VII-128	Punto de fusión 161-163
VII-175	Punto de fusión 160-162
VIII-1	Punto de fusión 178-179
VIII-7	Punto de fusión 159-161
VIII-13	Punto de fusión 182-183
VIII-27	Punto de fusión 104-107
VIII-125	Punto de fusión 123-126

Para los compuestos Nos. V-7, V-14, V-29, V-35, V-40, V-51, V-58, V-60, V-61, V-62, V-64, V-71, V-72, V-73, V-101, V-113, V-117, V-119, V-152, V-154, V-156, V-158, V-160, V-162, V-179, V-186, V-197, V-205, V-211, V-216, V-217, V-218, V-226, V-310, V-319, VI-1, VI-6, VI-7, VI-13, VI-21, VI-27, VI-31, VI-33, VI-36, VI-37, VI-49, VI-54, VI-55, VI-57, VI-88, VI-94, VI-115, VI-116, VI-117, VI-121, VI-122, VI-123, VI-125, VI-133, VI-134, VI-144, VI-150, VI-152, VI-153, VI-156, VI-157, VI-159, VI-160, VI-161, VI-162, VI-165, VI-170, VI-173, VI-185, VI-189, VI-195, VI-198, VI-242, VI-243, VI-248, VII-59, VII-67, VII-91, VII-97, VII-102, VII-153, VII-154, VII-156, VII-171, VII-173, VII-176, VII-177, VII-178, VII-180, VII-181, VII-185, VII-186, VII-187, VII-188, VIII-2, VIII-3, VIII-4, VIII-5, VIII-6, VIII-11, VIII-12, VIII-15, VIII-16, VIII-22, VIII-28, VIII-53, VIII-54, VIII-55, VIII-56, VIII-57, VIII-58, VIII-76, VIII-84, VIII-98, VIII-99, VIII-100, VIII-101, VIII-102, VIII-103, VIII-104, VIII-106, VIII-107, VIII-108, VIII-109, VIII-113, VIII-114, VIII-116, VIII-117, VIII-118, VIII-121, VIII-126, VIII-127, VIII-128, VIII-132, VIII-133, VIII-134, VIII-135, VIII-136, VIII-137, VIII-139, VIII-142, VIII-143, VIII-144, VIII-145, VIII-150, VIII-152, VIII-153, VIII-154, VIII-155, VIII-156, VIII-157, VIII-158, VIII-159, VIII-160, VIII-161, VIII-162, VIII-163, VIII-164, VIII-165, VIII-166, VIII-167, VIII-168, VIII-169, VIII-170, VIII-171, VIII-172, VIII-173, VIII-174, VIII-175, VIII-176, VIII-177, VIII-178, VIII-179, VIII-180, VIII-181, VIII-182, VIII-183, VIII-184, VIII-185, VIII-187, VIII-190, VIII-192, VIII-193, VIII-194, VIII-195, VIII-196, VIII-197, VIII-198, VIII-199, VIII-200, VIII-201, VIII-202, VIII-203, VIII-204, VIII-208, VIII-209, VIII-210, VIII-211, VIII-212, VIII-213, VIII-214, VIII-215, VIII-216 and VIII-218, se presentan los datos de RMN-¹H a continuación.

Compuesto N° V-7:

1,04 (3H, t), 1,43-1,56 (2H, m), 1,78-1,86 (2H, m), 4,41 (2H, t), 7,51 (1H, d), 7,58 (1H, dd), 7,84 (1H, m), 8,28 (1H, dd), 14,33 (1H, sa)

Compuesto N° V-14:

0,92 (3H, t), 1,35-1,38 (4H, m), 1,49 (2H, m), 1,83 (2H, m), 4,39 (2H, t), 7,51 (1H, d), 7,58 (1H, m), 7,84 (1H, m), 8,28 (1H, d), 14,33 (1H, sa)

Compuesto N° V-29:

3,49 (3H, s), 5,86 (2H, s), 7,59 (1H, t), 7,70 (1H, d), 7,83 (1H, t), 8,25 (1H, dd)

ES 2 389 320 T3

- Compuesto N^o. V-35:
4,14 (2H, q), 5,98 (2H, s), 7,60 - 7,68 (2H, m), 7,86 (1H, t), 8,26 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-40:
2,65 (2H, t), 3,93 (2H, t), 5,95 (2H, s), 7,62 (1H, t), 7,71 (1H, d), 7,86 (1H, t), 8,26 (1H, dd), 13,66 (1H, bs)
- 5 Compuesto N^o. V-51:
3,18 (3H, s), 5,86 (2H, s), 7,50 (1H, m), 7,72-7,80 (2H, m), 7,91 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-58:
3,33 (3H, s), 3,84 (2H, t), 4,62 (2H, t), 7,59 (1H, t), 7,71 (1H, d), 7,82 (1H, t), 8,25 (1H, dd), 14,20 (1H, bs)
- 10 Compuesto N^o. V-60:
1,68 (3H, d), 3,31 (3H, s), 3,79-3,84 (1H, m), 4,21-4,28 (1H, m), 4,87-5,28 (1H, m), 7,55 (1H, t), 7,72 (1H, d),
7,79 (1H, t), 8,26 (1H, dd), 14,28 (1H, bs)
- Compuesto N^o. V-61:
2,28 (3H, s), 2,92 (2H, m), 4,63 (2H, m), 7,51-7,62 (2H, m), 7,86 (1H, m), 8,28 (1H, dd)
- 15 Compuesto N^o. V-62:
3,11 (3H, s), 3,54 (2H, t), 4,89 (2H, t), 7,61-7,69 (2H, m), 7,91 (1H, dd), 8,30 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-64:
2,44 (3H, s), 5,26 (2H, t), 7,15 (1H, d), 7,58 (1H, t), 7,78 (1H, t), 8,27 (1H, dd), 13,70 (1H, bs)
- Compuesto N^o. V-71:
3,66- 3,78 (6H, m), 3,84 - 3,87 (3H, m), 7,31 (1H, d), 7,53 (1H, t), 7,77 (1H, t), 8,15 (1H, dd)
- 20 Compuesto N^o. V-72:
5,38 (2H, t), 7,50 - 7,57 (2H, m), 7,80 (1H, t), 8,04 (1H, dd)
- Compuesto N^o. V-73:
2,99 (2H, t), 4,55 (2H, t), 7,46 (1H, t), 7,43 (1H, t), 7,82 (1H, d), 7,89 (1H, d), 13,98 (1H, bs)
- 25 Compuesto N^o. V-101:
7,04 (1H, d), 7,11 (1H, d), 7,52-7,54 (2H, m), 7,57-7,71 (2H, m), 8,29 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-113:
7,08 (1H, d), 7,61 (1H, t), 7,71 (1H, t), 7,77 (1H, d), 8,04 (1H, d), 8,30 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-117:
2,84 (3H, s), 6,98 (1H, d), 7,62 (1H, t), 7,74 (1H, t), 8,30 (1H, d)
- 30 Compuesto N^o. V-119:
3,91 (3H, s), 6,90 (1H, d), 7,67 (1H, t), 7,79 (1H, t), 8,31 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-152:
6,74 (1H, d), 7,64 (2H, m), 8,33 (1H, d), 8,85 (2H, s), 8,93 (1H, s), 13,32 (1H, bs)
- 35 Compuesto N^o. V-154:
3,33-3,38 (2H, m), 4,74(2H, t), 2,37-2,44 (1H, m), 2,90-2,92 (2H, m), 6,98 (1H, d), 7,03 (2H, s), 7,12 (1H, s),
7,55 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-156:
6,89(1H, d), 7,09 (2H, m), 7,37 (1H, d), 7,59 (1H, t), 7,68 (1H, t), 8,32 (1H, d)
- 40 Compuesto N^o. V-158:
4,35-4,39 (4H, m), 6,78 (1H, dd), 6,85 (1H, d), 6,99 (1H, dd), 7,14 (1H, d), 7,55 (1H, m), 7,66 (1H, d), 8,29 (1H,
dd), 13,97 (1H, sa)
- Compuesto N^o. V-160:
1,78-1,82 (1H, m), 1,96-2,03 (2H, m), 1,29-2,22 (1H, m), 3,76 (1H, q), 3,90 (1H, q), 4,37-4,48 (2H, m), 4,59
(1H, dd), 4,56 (1H, t), 7,72 (1H, d), 7,81 (1H, t), 8,24 (1H, d), 14,05 (1H, bs)
- 45 Compuesto N^o. V-162:
2,28 (3H, s), 5,66 (2H, s), 7,62 (1H, t), 7,71 (1H, d), 7,87 (1H, t), 8,28 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-179:
3,34 (3H, s), 3,81 (2H, t), 5,20 (2H, t), 7,49 (1H, t), 7,84 (1H, dd), 8,20 (1H, t), 13,96 (1H, bs)

- Compuesto N^o. V-186:
3,67 (3H, s), 3,96 (3H, s), 7,05-7,11 (2H, m), 7,82 (1H, d), 13,88 (1H, a)
- Compuesto N^o. V-197:
3,82 (3H, m), 7,58 (1H, d), 8,53 (1H, d), 8,88 (1H, s)
- 5 Compuesto N^o. V-205:
6,68 (1H, d), 7,20 (1H, d), 7,48-7,64 (5H, m), 7,74 (1H, t), 8,06 (1H, d), 8,17 (1H, d), 8,37 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-211:
6,98 (1H, s), 7,51 (1H, t), 7,64 (1H, t), 7,95 (1H, s), 9,32 (1H, s)
- 10 Compuesto N^o. V-216:
1,20-1,31 (9H, m), 3,44 (1H, m), 3,55 (1H, m), 4,12 (1H, m), 5,31 (2H, a), 7,13 (1H, a), 7,56 (1H, a), 7,71 (1H, a), 8,25 (1H, a)
- Compuesto N^o. V-217:
3,36 (3H, s), 4,77 (2H, s), 6,95 (3H, m), 7,27 (1H, d), 7,58 (1H, t), 7,67 (1H, t), 8,31 (1H, d)
- 15 Compuesto N^o. V-218:
3,70 (3H, s), 3,91(3H, s), 6,61 (1H, d), 6,92 (1H, d), 7,08 (1H, d), 7,25 (2H, s), 7,51-7,61 (4H, m), 8,30 (1H, d)
- Compuesto N^o. V-226:
2,55 (3H, s), 6,77 (1H, d), 7,37 (1H, d), 7,50 (1H, d), 7,93 (1H, d), 8,22 (1H, d), 8,65 (1H, s)
- Compuesto N^o. V-310:
4,06 (3H, s), 6,84 (1H, d), 7,05 (1H, d), 7,52-7,66 (m, 3H), 8,15 (1H, S)
- 20 Compuesto N^o. V-319:
3,75 (3H, s), 6,97 (2H, t), 7,58 (1H, t), 7,66-7,72 (2H, m), 8,30 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-1:
6,87 (1H, d), 7,34 (2H, d), 7,54-7,74 (5H, m), 8,31 (1H, d)
- 25 Compuesto N^o. VI-6:
6,87 (1H, d), 7,27 (1H, m), 7,38 (1H, s), 7,56-7,70 (4H, m), 8,31 (1H, d), 13,33 (1H, s a)
- Compuesto N^o. VI-7:
6,88 (1H, dd), 7,30-7,33 (2H, m), 7,57 (1H, m), 7,58-7,70 (3H, m), 8,30 (1H, dd), 13,71 (1H, s a)
- Compuesto N^o. VI-13:
2,52 (3H, s), 6,92 (1H, dd), 7,21-7,24 (2H, m), 7,47-7,67 (4H, m), 8,29 (1H, dd), 13,91 (1H, s a)
- 30 Compuesto N^o. VI-21:
1,32 (6H, d), 3,05 (1H, m), 6,87 (1H, dd), 7,13-7,18 (2H, m), 7,52-7,66 (4H, m), 8,31 (1H, dd), 13,99 (1H, s a)
- Compuesto N^o. VI-27:
6,81 (1H, d), 7,58-7,62 (2H, m), 7,66-7,71 (2H, m), 7,88 (1H, dd), 7,95 (1H, d), 8,32 (1H, d), 13,58 (1H, s a)
- 35 Compuesto N^o. VI-31:
6,89 (1H, d), 7,05-7,13 (4H, m), 7,47 (1H, t), 7,58 (1H, t), 8,09 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-33:
3,88 (3H, s), 6,85 11H, dd), 6,89-6,94 (2H, m), 7,19 (1H, dd), 7,54-7,68 (3H, m), 8,31 (1H, dd), 13,76 (1H, s a)
- Compuesto N^o. VI-36:
1,45 (3H, t), 4,09 (2H, m), 6,83-6,94 (3H, m), 7,17 (1H, dd), 7,53-7,67 (3H, m), 8,30 (1H, dd)
- 40 Compuesto N^o. VI-37:
1,50 (3H, t), 4,15 (2H, q), 6,94 (1H, d), 7,14-7,28 (4H, m), 7,53-7,66 (2H, m), 8,30 (1H, dd), 13,98 (1H, s a)
- Compuesto N^o. VI-49:
4,65 (2H, d), 5,37 (1H, d), 5,48 (1H, d), 6,06-6,15 (1H, m), 6,93 (1H, d), 7,17-7,26 (4H, m), 7,56 (1H, t), 7,64 (1H, t), 8,30 (1H, d).
- 45 Compuesto N^o. VI-54:
6,62 (1H, t), 6,86 (1H, m), 7,15 (1H, m), 7,21 (1H, d), 7,44 (1H, d), 7,67 (3H, m), 8,32 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-55:
6,82 (1H, t), 6,84 (1H, d), 7,30-7,44 (4H, m), 7,59 (1H, t), 7,61 (1H, t), 8,17 (1H, d)

- Compuesto N^o. VI-57:
6,85 (1H, dd), 7,32 (1H, d), 7,53-7,62 (2H, m), 7,68 (1H, m), 7,77 (1H, dd), 8,33 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VI-88:
2,73 (3H, s), 6,83 (1H, d), 7,48 (1H, d), 7,59 (1H, t), 7,64 (1H, t), 8,27-8,34 (3H, m)
- 5 Compuesto N^o. VI-94:
4,01 (3H, s), 6,81 (1H, d), 7,43-7,65 (4H, m), 8,31-8,43 (3H, m)
- Compuesto N^o. VI-115:
3,94 (3H, s), 6. 87-6. 93 (3H, m), 7,58 (1H, dd), 7,65-7,70 (2H, m), 8,31 (1H, m)
- 10 Compuesto N^o. VI-116:
2,35 (3H, s), 3,85 (3H, s), 6,72 (1H, d), 6,82 (1H, dd), 6,95 (1H, dd), 7,42 (1H, d), 7,56 (1H, m), 7,65 (1H, m), 8,30 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VI-117:
3,90 (3H, s), 4,00 (3H, s), 6,79 (1H, d), 6,89-6,97 (2H, m), 7,13 (1H, d), 7,57 (1H, m), 7,66 (1H, m), 8,30 (1H, d), 13,76 (1H, s a)
- 15 Compuesto N^o. VI-121:
3,84 (6H, s), 6,43-6,45 (2H, m), 6,70 (1H, dd), 6,98 (1H, d), 7,56 (1H, m), 7,66 (1H, m), 8,30 (1H, m)
- Compuesto N^o. VI-122:
3,90 (3H, s), 6,92-6,99 (2H, m), 7,08 (1H, d), 7,25 (1H, d), 7,57 (1H, t), 7,68 (1H, t), 8,30 (1H, d)
- 20 Compuesto N^o. VI-123:
3,93 (3H, s), 6,81 (1H, d), 7,08 (1H, d), 7,23-7,30 (2H, m), 7,57 (1H, t), 7,66 (1H, t), 8,32 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-125:
3,74 (1H, s), 3,92 (1H, s), 6,72 (2H, m), 6,91 (1H, d), 7,16 (1H, m), 7,53 (1H, t), 7,63 (1H, t), 8,29 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-133:
3,88 (6H, s), 3,97 (3H, s), 6,54 (2H, s), 6,97 (1H, d), 7,58 (1H, m), 7,69 (1H, m), 8,30 (1H, d), 13,60 (1H, s a)
- 25 Compuesto N^o. VI-134:
3,93 (s, 3H), 6,71 (d, 1H), 7,16-7,29 (m, 5H), 7,58 (m, 1H)
- Compuesto N^o. VI-144:
3,94 (3H, s), 6,89 (1H, s), 7,18-7,24 (4H, m), 7,52 (1H, d), 8,22 (1H, d)
- 30 Compuesto N^o. VI-150:
0,39-0,43 (2H, m), 0,69-0,74 (2H, m), 1,31-1,37 (1H, m), 3,91 (2H, d), 6,93 (1H, d), 7,16-7,24 (2H, m), 7,57 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-152:
3,08 (6H, s), 6,88 (2H, d), 6,90 (1H, d), 7,13 (2H, d), 7,53 (1H, t), 7,61 (1H, t), 8,28 (1H, d)
- 35 Compuesto N^o. VI-153:
2,38 (3H, s), 2,41 (3H, s), 6,91 (1H, d), 7,01-7,08 (2H, m), 7,44 (1H, d), 7,55 (1H, t), 7,61 (1H, t), 8,29 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-156:
2,40 (3H, d), 6,88 (1H, d), 7,15 (2H, m), 7,33 (1H, t), 7,57 (1H, t), 7,66 (1H, t), 8,30(H, d)
- Compuesto N^o. VI-157:
2,51 (3H, s), 6,78 (1H, d), 7,25 (1H, d), 7,39 (1H, d), 7,55-7,68 (3H, m), 8,32 (1H, d)
- 40 Compuesto N^o. VI-159:
1,49 (3H, t), 3,99 (3H, s), 4,12 (2H, m), 6,77 (1H, d), 6,88 (1H, m), 6,95 (1H, d), 7,11 (1H, d), 7,56 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,30 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-160:
3,81 (3H, s), 3,97 (6H, d), 6,88-6,96 (3H, m), 7,57 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)
- 45 Compuesto N^o. VI-161:
4,01 (3H, s), 6,95 (1H, d), 7,05 (1H, m), 7,12 (1H, m), 7,58 (1H, t), 7,70 (1H, m), 8,32 (1H, m)
- Compuesto N^o. VI-162:
4,16(3H, s), 6,97(3H, m), 7,60(1H, t), 7,70(1H, t), 8,31(1H, d)

- Compuesto N^o. VI-165:
1,68-1,81 (4H, m), 2,10-2,16 (1H, m), 2,37-2,44 (1H, m), 2,90-2,92 (2H, m), 6,99-7,02 (1H, m), 7,37 (2H, t), 7,56-7,68 (2H, m), 8,31 (1H, d)
- 5 Compuesto N^o. VI-170:
2,30 (2H, m), 4,30 (2H, m), 4,43 (2H, m), 6,86 (1H, m), 6,93 (2H, m), 7,22 (2H, d), 7,55 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-173:
4,16 (3H, s), 6,70 (1H, d), 6,95(2H, m), 7,25 (1H, t), 7,65 (1H, m))
- 10 Compuesto N^o. VI-185:
2,43 (3H, s), 3,94 (3H, s), 6,67 (1H, s), 7,22 (4H, m), 7,35 (1H, s), 8,16 (1H, s), 13,99 (1H, s)
- Compuesto N^o. VI-189:
3,91 (3H, s), 3,92 (3H, s), 6,86 (1H, d), 7,20 (5H, m), 7,71 (1H, s)
- Compuesto N^o. VI-195:
3,45 (3H, s), 3,90 (3H, s), 7,05 (2H, d), 7,19 (3H, d), 7,48 (1H, t), 7,92 (1H, d)
- 15 Compuesto N^o. VI-198:
6,67 (1H, dd), 7,32 (2H, d), 7,68-7,76 (3H, m), 8,12 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VI-242:
3,80 (3H, s), 6,17 (1H, d), 7,13 (1H, m), 7,35 (4H, m), 8,20 (1H, d)
- 20 Compuesto N^o. VI-243:
3. 81 (3H, s), 6,18 (1H, d), 6,66 (1H, t), 7,14 (1H, m), 7,35 (2H, d), 7,44 (2H, d), 8,22 (1H, d)
- Compuesto N^o. VI-248:
6,64 (1H, d), 7,28-7,43 (5H, m), 7,62 (1H, m)
- Compuesto N^o. VII-59:
3,56 (3H, s), 3,86 (2H, t), 4,91 (2H, t), 7.55 - 7,59 (1H, m), 8,58 (1H, dd), 8,84 (1H, dd), 14,01 (1H, bs)
- 25 Compuesto N^o. VII-67:
1,32 (3H, t), 2,28 (2H, q), 5,38 (2H, s), 7,56-7,61 (1H, m), 8,60 (1H, d), 8,79 (1H, d)
- Compuesto N^o. VII-91:
3,86 (3H, s), 5,87 (2H, s), 6,78 (2H, q), 6,92 (1H, d), 7,29 (1H, s), 7,55 (1H, q), 8,60 (1H, d), 8,80 (1H, d)
- 30 Compuesto N^o. VII-97:
2,08 (3H, d), 7,32 (4H, m), 7,44 (2H, m), 7,57 (1H, m), 8,57 (1H, m), 8,82 (1H, d)
- Compuesto N^o. VII-102:
7,12 (1H, d), 7,43-7,47 (1H, m), 7,55-7,58 (2H, m), 8,31 (H, d), 8,56 (1H, d)
- Compuesto N^o. VII-153:
6,13 (1H, s), 6,77 (2H, m), 7,04 (1H, m), 7,57 (1H. m), 8. 62 (1H, m), 8,73 (1H, d)
- 35 Compuesto N^o. VII-154:
7,05(2H, m), 7,32 (1H, d), 7,60 (1H, q), 8,68(2H, m)
- Compuesto N^o. VII-156:
4,35 (4H, m), 6,77 (1H, q), 6,85 (1H, d), 7,11 (1H, d), 7,56 (1H, q), 8,62 (1H, q), 8,74 (1H, q)
- 40 Compuesto N^o. VII-171:
1,57 (3H, s), 1,67 (3H, s), 2,51 (2H, q), 4,63 (2H, t), 5,22 (1H, t), 7,54 - 7,58 (1H, m), 8,56 (1H, d), 8,85 (1H, d), 14,12 (1H, bs)
- Compuesto N^o. VII-173:
1,74 (3H, t), 2,52 (2H, t), 4,75 (2H, t), 7,56 - 7. 67 (1H, m), 8,58 (1H, d), 8,84 (1H, d), 14,00 (1H, bs)
- 45 Compuesto N^o. VII-176:
3,10 (2H, t), 4,86 (2H, t), 7,24-7,31 (5H, m), 7,56 (1H, q), 8,57 (1H, d), 8,84 (1H, d)
- Compuesto N^o. VII-177:
5,99 (2H, s), 6,95 (1H, q), 7,25 (1H, q), 7,36 (1H, d), 7,60 (1H, q), 8,57 (1H, dd), 8,93 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VII-178:

- 6,54 (1H, d), 6,98 (2H, s), 7,64 (1H, q), 8,05 (1H, d), 8,58 (1H, dd), 8,92 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VII-180:
2,37 (3H, s), 5,75 (2H, s), 6,07 (1H, s), 7,47 (1H, q), 8,34 (1H, dd), 8,71 (1H, dd)
- 5 Compuesto N^o. VII-181:
5,81 (2H, s), 7,30 (1H, d), 7,62 (1H, q), 7,95 (1H, dd), 8,59 (1H, dd), 8,72 (1H, d), 8,89 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VII-185:
2,86 (3H, s), 5,82 (2H, s), 7,28-7,33 (3H, m), 7,39 (1H, d), 7,54 (2H, t), 8,69 (1H, d)
- Compuesto N^o. VII-186:
2,54 (3H, s), 5,82 (2H, s), 7,28-7,33 (3H, m), 7,55 (2H, t), 8,34 (1H, d), 8,72 (1H, d)
- 10 Compuesto N^o. VII-187:
2,81 (3H, s), 5,83 (2H, s), 7,29-7,36 (3H, m), 7,41 (1H, d), 7,58 (2H, t), 8,42 (1H, d)
- Compuesto N^o. VII-188:
4,14 (3H, s), 5,76 (2H, s), 6,96 (1H, d), 7,32-7,37 (3H, m), 7,49 (2H, dd), 8,36 (1H, d)
- 15 Compuesto N^o. VIII-2:
7,36-7,46 (3H, m), 7,56-7,67 (2H, m), 8,63-8,70 (2H, m), 13,36 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-3:
7,08-7,15 (2H, m), 7,31-7,38 (1H, m), 7,57-7,68 (2H, m), 8,63-8,71 (2H, m), 13,32 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-4:
7,27-7,38 (4H, m), 7,58 (1H, dd), 8,63-8,71 (2H, m), 13,57 (1H, a)
- 20 Compuesto N^o. VIII-5:
7,36-7,40 (1H, m), 7,55-7,72 (4H, m), 8,64-8,69 (2H, m), 13,08 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-6:
7,22-7,26 (1H, m), 7,36 (1H, s), 7,57-7,61 (3H, m), 8,64 (1H, dd), 8,70 (1H, dd), 13,29 (1H, a)
- 25 Compuesto N^o. VIII-11:
2,07 (3H, s), 7,18 (1H, d), 7,44-7,59 (4H, m), 8,62 (1H, d), 8,70-8,72 (1H, m), 13,40 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-12:
2,48 (3H, s), 7,10-7,13 (2H, m), 7,44 (1H, d), 7,53-7,58 (2H, m), 8,64 (1H, dd), 8,71 (1H, dd), 13,71 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-15:
1,31(3H, t), 2,79(2H, q), 7,13(2H, m), 7,46 (1H, d), 7,55(2H, m), 8,63 (1H, m), 8,71 (1H, m)
- 30 Compuesto N^o. VIII-16:
1,39(3H, t), 2,80(2H, q), 7,24 (2H, d), 7,48(2H, d), 7,55 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,72 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-22:
1,35 (6H, d), 3,06 (1H, m), 7,25 (2H, d), 7,54 (3H, m), 8,63 (1H, m), 8,71 (1H, m)
- 35 Compuesto N^o. VIII-28:
7,49 (2H, d), 7,60 (1H, q), 7,93 (2H, d), 8,63-8,69 (2H, m), 13,25 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-53:
6,40 (1H, t), 7,55(5H, m), 8,66(2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-54:
6,60 (1H, t), 7,13 (1H, s), 7,20 (1H, d), 7,39 (1H, d), 7,58 (1H, q), 7,67 (1H, t), 8,69 (2H, m)
- 40 Compuesto N^o. VIII-55:
6,65(1H, t), 7,36 (4H, m), 7,58 (1H, m), 8,67(2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-56:
7,43 (1H, d), 7,53-7,64 (3H, m), 7,68 (1H, d), 8,63-8,68 (2H, m)
- 45 Compuesto N^o. VIII-57:
7,24-7,32 (2H, m), 7,49 (2H, d), 7,59 (1H, q), 7,70 (1H, t), 8,63-8,70 (2H, m), 13,12 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-58:
7,37-7,41 (2H, m), 7,49 (2H, d), 7,58-7,61 (1H, m), 8,64-8,70 (2H, m), 13,48 (1H, a)

ES 2 389 320 T3

- Compuesto N^o. VIII-76:
7,40 (2H, d), 7,59 (1H, q), 7,93 (2H, d), 8,65 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-84:
7,61 (2H, q), 7,67 (1H, s), 7,79 (1H, t), 7,91 (1H, d), 8,66 (2H, q)
- 5 Compuesto N^o. VIII-98:
7,15-7,18 (1H, m), 7,37-7,41 (1H, m), 7,43-7,50 (1H, m), 7,59-7,62 (1H, m), 8,64-8,70 (2H, m), 13,20 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-99:
7,13-7,18 (1H, m), 7,36-7,41 (1H, m), 7,58-7,61 (1H, m), 8,59-8,70 (2H, m), 13,27 (1H, a)
- 10 Compuesto N^o. VIII-100:
7,13-7,18 (1H, m), 7,30-7,39 (2H, m), 7,59-7,62 (1H, m), 8,63-8,70 (2H, m), 10,81 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-101:
7,18-7,27 (2H, m), 7,57-7,63 (2H, m), 8,63-8,70 (1H, m), 12,55 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-102:
7,10-7,15 (1H, m), 7,20-7,27 (1H, m), 7,41-7,50 (1H, m), 7,58-7,62 (1H, m), 8,63-8,71 (2H, m), 12,80 (1H, a)
- 15 Compuesto N^o. VIII-103:
6,91-6,95 (2H, m), 7,06-7,13 (1H, m), 7,58-7,62 (1H, m), 8,63-8,71 (2H, m), 13,20 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-104:
7,32 (1H, dd), 7,43-7,49 (2H, m), 7,69 (1H, dd), 8,53 (1H, dd)
- 20 Compuesto N^o. VIII-106:
7,42-7,52 (3H, m), 7,59 (1H, d), 8,39 (1H, dd), 8,54 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-107:
7,52-7,62 (4H, m), 8,65-8,68 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-108:
7,20 (1H, dd), 7,47 (1H, d), 7,60 (1H, q), 7,73 (1H, d), 8,64 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)
- 25 Compuesto N^o. VIII-109:
7,28 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,46 (1H, q), 7,54 (1H, t), 8,38 (1H, dd), 8,60 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-113:
3,69 (3H, s), 3,95 (3H, s), 6,84 (1H, dd), 7,15 (1H, dd), 7,25 (1H, t), 7,44 (1H, q), 8,39 (1H, dd), 8,56 (1H, dd)
- 30 Compuesto N^o. VIII-114:
3,91 (1H, s), 6,84-6,92 (2H, m), 7,34 (1H, dd), 7,58 (1H, dd), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd), 13,55 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-116:
2,29 (3H, s), 3,81 (3H, s), 6,78 (1H, s), 6,80 (1H, dd), 7,33 (1H, d), 7,44 (1H, q), 8,37 (1H, dd), 8,58 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-117:
3,88 (3H, s), 3,97 (3H, s), 6,80 (1H, d), 6,89 (1H, dd), 7,09 (1H, d), 7,51 (1H, q), 8,53 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)
- 35 Compuesto N^o. VIII-118:
3,86 (3H, s), 6,64-6,68 (2H, m), 6,87 (1H, dt), 7,59 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-121:
3,82 (6H, s), 6,44 (1H, d), 6,65 (1H, d), 7,50 (1H, q), 8,51 (1H, dd), 8,67 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-126:
7,09 (2H, m), 7,21 (1H, t), 7,58(1H, q), 8,63 (1H, m), 8,72 (1H, m)
- 40 Compuesto N^o. VIII-127:
4,01 (3H, s), 7,21 (2H, m), 7,38 (1H, d), 7,58 (1H, q), 8,62 (1H, m), 8,71 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-128:
2,30 (3H, s), 3,93 (3H, s), 7,04-7,15 (3H, m), 7,56 (1H, q), 8,63 (1H, dd), 8,74 (1H, dd)
- 45 Compuesto N^o. VIII-132:
3,70 (3H, s), 3,82 (3H, s), 6,83 (1H, s), 7,11 (2H, s), 7,54 (1H, q), 8,62 (1H, d), 8,70 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-133:

- 3,87 (6H, s), 3. 97 (3H, s), 6,51 (2H, s), 7,56 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,76 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-134:
7,16 (1H, dd), 7,30 (2H, m), 7,61-7,69 (3H, m), 8,71 (1H, q)
- 5 Compuesto N^o. VIII-135:
3,91 (3H, s), 7,12-7,24 (5H, m), 8,70 (1H, q)
- Compuesto N^o. VIII-136:
7,29-7,32 (2H, m), 7,53 (1H, d), 7,59-7,69 (3H, m), 8,54 (1H, d)
- Compuesto N^o. VIII-137:
3,92 (3H, s), 7,13 (2H, d), 7,21 (2H, d), 7,52 (1H, d), 8,53 (1H, d)
- 10 Compuesto N^o. VIII-139:
3,73 (3H, s), 3,91 (3H, s), 6,93 (1H, d), 7,10 (2H, d), 7,23 (2H, d), 8,39 (1H, d)
- Compuesto N^o. VIII-142:
7,52 (1H, t), 7,61 (1H, m), 7,70 (1H, d), 7,91 (1H, m), 8,67 (2H, m)
- 15 Compuesto N^o. VIII-143:
7,56 (4H, m), 8,67 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-144:
7,59 (3H, m), 7,90 (1H, t), 8,67 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-145:
7,31 (1H, d), 7,44 (1H, s), 7,61 (2H, m), 8,65 (2H, m)
- 20 Compuesto N^o. VIII-150:
2,37 (3H, s), 2,39 (3H, s), 7,07 (2H, m), 7,42 (1H, d), 7,55 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,72 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-152:
7,62 (1H, q), 7,85 (2H, s), 8,12 (1H, s), 8,65-8,68 (2H, m)
- 25 Compuesto N^o. VIII-153:
3,73 (6H, s), 6,80 (2H, d), 7,47-7,53 (2H, m), 8,54 (1H, dd), 8,64 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-154:
7,29-7,45 (2H, m), 7,54-7,69 (2H, m), 8,60-8,68 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-155:
7,30 (1H, t), 7,42 (2H, d), 7,59 (1H, q), 8,64 (1H, d), 8,68 (1H, d)
- 30 Compuesto N^o. VIII-156:
7,30-7,46 (2H, m), 7,56-7,66 (2H, m), 8,64 (1H, dd), 8,69 (1H, d)
- Compuesto N^o. VIII-157:
7,11 (1H, d), 7,19 (1H, dd), 7,60 (1H, q), 7,69 (1H, t), 8,65 (1H, d), 8,69 (1H, d)
- 35 Compuesto N^o. VIII-158:
7,28-7,37 (1H, m), 7,38-7,45 (2H, m), 7,59 (1H, m), 8,62-8,68 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-159:
7,22-7,26 (1H, m), 7,40-7,45 (2H, m), 7,59 (1H, dd), 8,62-8,71 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-160:
2,41 (3H, d), 7,18 (1H, t), 7,32 (1H, t), 7,47 (1H, t), 7,58 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)
- 40 Compuesto N^o. VIII-161:
2,51 (3H, s), 7,18-7,29 (3H, m), 7,55-7,60 (1H, m), 8,63 (1H, d), 8,71 (1H, d), 13,35 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-162:
2,45 (3H, s), 7,16 (1H, dd), 7,27 (1H, t), 7,38-7,43 (1H, m), 7,58 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,71 (1H, dd)
- 45 Compuesto N^o. VIII-163:
1,94 (3H, d), 7,01 (1H, d), 7,31 (1H, t), 7,43 (1H, q), 7,59 (1H, q), 8,67 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-164:
2,41 (3H, d), 7. 02 (2H, d), 7,48(1H, t), 7,57 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,70 (1H, m)

- Compuesto N^o. VIII-165:
2,48 (3H, s), 6,88 (1H, d), 6,94 (1H, s), 7,15 (1H, d), 7,58 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-166:
7,12-7,18 (3H, m), 7,59 (1H, q), 8,64-8,72 (2H, m), 11,85 (1H, a)
- 5 Compuesto N^o. VIII-167:
7,11-7,19 (2H, m), 7,26-7,31 (1H, m), 7,58 (1H, dd), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd), 13,22 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-168:
1,99 (3H, s), 6,95 (1H, dd), 7,22-7,28 (1H, m), 7,46 (1H, q), 7,59 (1H, q), 8,66 (1H, dd), 8,71 (1H, dd)
- 10 Compuesto N^o. VIII-169:
7,59-7,72 (4H, m), 8,62-8,68 (2H, m), 9,57 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-170:
7,26-7,30 (2H, d), 7,62 (1H, dd), 7,91 (1H, t), 8,64-8,70 (2H, m), 12,16 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-171:
7,37-7,41 (1H, m), 7,52-7,60 (2H, m), 7,65-7,69 (1H, m), 8,62-8,65 (2H, m), 13,20 (1H, a)
- 15 Compuesto N^o. VIII-172:
3,87 (3H, d), 7,05 (1H, d), 7,22-7,28 (1H, m), 7,35-7,40 (1H, m), 7,57 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,69 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-173:
3,75 (1H, s), 6,88-6,95 (2H, m), 7,21-7,27 (1H, m), 7,56 (1H, dd), 8,63 (1H, dd), 8,69 (1H, dd), 13,67 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-174:
20 3,73 (3H, s), 7,05 (1H, dd), 7,12 (1H, dd), 7,28-7,34 (1H, m), 7,56 (1H, q), 8,62 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-175:
6,65 (1H, t), 7,20 (2H, m), 7,39 (1H, t), 7,59 (1H, q), 8,68 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-176:
6,69 (1H, t), 7,14 (1H, m), 7,22 (1H, m), 7,52 (1H, t), 7,59 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,69 (1H, m)
- 25 Compuesto N^o. VIII-177:
6,42 (1H, t), 7,18-7,25 (2H, m), 7,37-7,42 (1H, m), 7,59 (1H, m), 8,62-8,68 (2H, m), 12,34 (1H, a)
- Compuesto N^o. VIII-178:
7,51 (1H, t), 7,60-7,67 (3H, m), 8,65 (2H, d)
- Compuesto N^o. VIII-179:
30 2,49 (3H, s), 7,23 (1H, d), 7,36 (1H, m), 7,52 (1H, s), 7,57 (1H, q), 8,66 (2H, m)
- Compuesto N^o. VIII-180:
2,51 (3H, s), 7,14 (1H, d), 7,34 (1H, s), 7,56 (2H, m), 8,63 (1H, d), 8,70 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-181:
6,67 (1H, t), 7,25 (2H, m), 7,50 (2H, m), 7,59 (1H, q), 8,68 (2H, m)
- 35 Compuesto N^o. VIII-182:
2,64 (3H, s), 7,42 (1H, d), 7,60 (3H, t), 8,65 (1H, d), 8,70 (1H, t)
- Compuesto N^o. VIII-183:
2,49 (3H, s), 3,73 (3H, s), 6,98 (1H, s), 7,02 (1H, d), 7,13 (1H, d), 7,53 (1H, q), 8,62 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-184:
40 2,68 (3H, s), 7,29 (1H, dd), 7,33 (1H, s), 7,60 (1H, q), 7,89 (1H, d), 8,65 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-185:
2,70 (3H, s), 7,47 (1H, dd), 7,58-7,63 (3H, m), 8,65 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)
- Compuesto N^o. VIII-187:
6,96 (6H, m), 7,24 (1H, m), 7,62 (1H, q), 8,66 (2H, m)
- 45 Compuesto N^o. VIII-190:
2,45 (3H, s), 7,04 (1H, t), 7,22 (1H, t), 7,59 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,69 (1H, m)
- Compuesto N^o. VIII-192:

	4,14 (3H, s), 6,93 (2H, m), 7,59 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,70 (1H, m)
	Compuesto N ^o . VIII-193: 2,36 (3H, s), 7,20 (1H, d), 7,36 (1H, d), 7,59 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,69 (1H, m)
5	Compuesto N ^o . VIII-194: 7,30 (2H, dd), 7,60-7,71 (3H, m), 8,61 (2H, q)
	Compuesto N ^o . VIII-195: 2,56 (3H, s), 7,30 (2H, d), 7,40 (1H, d), 7,58-7,66 (3H, m), 8,47 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-196: 2,53 (3H, s), 7,31 (2H, m), 7,65 (3H, m), 8,40 (1H, s), 8,52 (1H, s)
10	Compuesto N ^o . VIII-197: 2,92 (3H, s), 7,30 (2H, d), 7,38 (1H, d), 7,59-7,68 (3H, m), 8,51 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-198: 2,48 (3H, s), 2,92 (3H, s), 7,10 (2H, d), 7,40 (2H, q), 7,54 (1H, t), 8,53 (1H, d)
15	Compuesto N ^o . VIII-199: 2,91 (3H, s), 7,40 (1H, d), 7,52 (1H, d), 7,60 (1H, s), 7,79 (1H, t), 7,87 (1H, d), 8,49 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-200: 2,91 (3H, s), 3,90 (3H, s), 7,14 (2H, d), 7,22 (2H, d), 7,37 (1H, d), 8,54 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-201: 2,40 (3H, d), 2,91 (3H, s), 7,00 (2H, d), 7,39 (1H, d), 7,46 (1H, d), 8,52 (1H, d)
20	Compuesto N ^o . VIII-202: 2,91 (3H, s), 3,99 (3H, s), 7,04-7,09 (2H, m), 7,17 (1H, t), 7,39 (1H, d), 8,53 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-203: 4,17 (3H, s), 6,95 (1H, d), 7,28-7,32 (2H, m), 7,58-7,69 (3H, m), 8,51 (1H, d)
25	Compuesto N ^o . VIII-204: 4,18 (3H, s), 6,97 (1H, d), 7,52 (1H, d), 7,60 (1H, s), 7,81 (1H, t), 7,87 (1H, d), 8,48 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-208: 2,41 (3H, d), 2,53 (3H, s), 7,02 (2H, d), 7,47 (1H, t), 8,40 (1H, q), 8,53 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-209: 2,42 (3H, d), 2,59 (3H, s), 7,00 (2H, d), 7,43 (2H, q), 8,46 (1H, d)
30	Compuesto N ^o . VIII-210: 7,30 (2H, d), 7,61-7,70 (4H, m), 8,53 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-211: 2,41 (3H, s), 3,74 (3H, s), 6,94 (1H, d), 7,02 (2H, m), 7,43 (1H, t), 8,40 (1H, d)
35	Compuesto N ^o . VIII-212: 1,44 (3H, t), 4,08 (2H, q), 6,82 (1H, s), 6,87 (1H, d), 7,13 (1H, d), 7,53-7,58 (2H, m), 8,63 (1H, d), 8,72 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-213: 1,48 (3H, t), 4,13 (2H, q), 7,15 (2H, d), 7,23 (2H, d), 7,56 (1H, m), 8,63 (1H, d), 8,72 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-214: 3,91 (3H, s), 7,12 (2H, d), 7,21 (2H, d), 7,59 (1H, d), 8,55 (1H, d)
40	Compuesto N ^o . VIII-215: 2,15 (3H, s), 7,31-7,36 (3H, m), 7,59-7,66 (3H, m), 8,27 (1H, d)
	Compuesto N ^o . VIII-216: 3,77 (3H, s), 4,35 (4H, s), 6,77 (1H, dd), 6,85 (1H, d), 6,93 (1H, d), 7,05 (1H, d), 8,39 (1H, d)
45	Compuesto N ^o . VIII-218: 6,13 (2H, s), 6,72-6,77 (2H, m), 7,03 (1H, d), 7,61 (1H, d), 8,57 (1H, d)

Para los intermedios de producción obtenidos en el Ejemplo 7 y Ejemplos 8 así como también los intermedios producidos de la misma forma, se presentan los siguientes datos de RMN-¹H (valor de DCI₃/TMS δ (ppm)):

ES 2 389 320 T3

- Compuesto N^o. X-1:
6,77 (1H, d) , 7,29-7,67 (7H, m), 8,06 (d, 1H)
- Compuesto N^o. X-6:
6,78 (1H, d), 7,21-7,62 (6H, m), 8,06 (1H, d)
- 5 Compuesto N^o. X-7:
6,77 (1H, d), 7,26 (2H, d), 7,45 (1H, t), 7,55-7,63 (3H, m), 8,09 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-9:
2,48 (1H, s), 6,80 (1H, d), 7,17 (2H, d), 7,39-7,45 (3H, m), 7,54 (1H, t), 8,04 (1H, d)
- 10 Compuesto N^o. X-12:
1,29 (d, 6H), 3,00 (1H, m), 6,77 (1H, d), 7,09-7,14 (2H, m), 7,40-7,46 (2H, m), 7,52-7,57 (2H, m), 8,05 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-14:
6,71 (1H, d), 7,45-7,62 (4H, m), 7,78-7,89 (2H, m), 8,09 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-17:
3,74 (3H, s), 6,74 (1H, d), 7,14-7,24 (3H, m), 7,41 (1H, t), 7,51-7,58 (2H, m), 8,05 (1H, d)
- 15 Compuesto N^o. X-18:
3,84 (3H, s), 6,80-6,89 (3H, m), 7,12 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,49-7,61 (2H, m), 8,05 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-20:
1,43 (3H, t), 4,06 (2H, m), 6,79 (3H, m), 7,11 (1H, d), 7,40-7,58 (3H, m), 8,04 (1H, d)
- 20 Compuesto N^o. X-21:
1,48 (3H, t), 4,12 (2H, q), 6,83 (1H, d), 7,10 (2H, d), 7,19 (2H, d), 7,44 (1H, t), 7,54 (1H, t), 8,04 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-29:
6,75 (1H, d), 7,22-7,29 (2H, m), 7,56-7,72 (4H, m), 8,08 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-43:
3,91 (3H, s), 6,80-6,88 (3H, m), 7,46 (1H, t), 7,55-7,64 (2H, m), 8,07 (1H, d)
- 25 Compuesto N^o. X-44:
2,31 (3H, s), 3,82 (3H, s), 6,70 (3H, s), 6,76-6,85 (2H, m), 7,35-7,57 (3H, m), 8,04 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-45:
3,87 (3H, s), 3,98 (3H, s), 6,76 (1H, d), 6,85 (1H, dd), 7,07 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,56 (1H, t), 8,05 (1H, d)
- 30 Compuesto N^o. X-46:
3,82 (6H, s), 6,42 (2H, s), 6,64 (1H, s), 6,87 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,57 (1H, t), 8,04 (1H, d)
- Compuesto N^o. X-53:
3,85 (6H, s), 3,94 (3H, s), 6,50 (2H, s), 6,86 (1H, d), 7,45 (1H, t), 7,59 (1H, t), 8,05 (1H, d)
- Compuesto N^o. IX-6:
1,01 (3H, t), 1,47 (2H, m), 1,78 (2H, m), 4,32 (2H, m), 7,39-7,53 (2H, m), 7,76 (1H, t), 8,03 (1H, d)
- 35 Compuesto N^o. IX-9:
0,90 (3H, t), 1,30-1,51 (6H, m), 1,78 (2H, m), 4,29 (2H, t), 7,40-7,47 (2H, m), 7,75 (1H, t), 8,04 (1H, d)
- Compuesto N^o. IX-28:
2,28 (3H, s), 2,85 (2H, t), 4,51 (2H, t), 7,41-7,70 (2H, m), 7,79 (1H, t), 8,12 (1H, d)
- Compuesto N^o. IX-29:
3,09 (3H, s), 3,49 (2H, t), 4,77 (2H, t), 7,50-7,58 (2H, m), 7,84 (1H, t), 8,08 (1H, d)
- 40 Compuesto N^o. IX-73 :
6,12 (2H, d), 6,74-6,76 (2H, m), 6,88 (1H, d), 7,01 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,57 (1H, t), 8,04 (1H, d)
- Compuesto N^o. IX-75:
4,33 (4H, s), 6,74-6,89 (3H, m), 7,08 (1H, d), 7,44 (1H, t), 7,55 (1H, t), 8,02 (1H, d)
- 45 En lo sucesivo, se describen procedimientos de preparación con detalle con referencia a los Ejemplos de Preparación. El tipo de compuestos y de aditivos, y las proporciones de incorporación se pueden variar en un intervalo amplio, sin que se encuentren limitados a los que se proporcionan a continuación. En la siguiente descripción, "parte" significa partes en peso.

Ejemplo de Preparación 1. Formulación de polvo humectable

Compuesto del Compuesto N°. I-12	10 partes
Poli(éter de fenilo y oxietilen octilo)	0,5 partes
Condensado de formalina-sal de sodio de ácido β naftalensulfónico	0,5 partes
Tierras diatomeas	20 partes
Arcilla	69 partes

5 Se mezclaron de manera uniforme los componentes anteriores para obtener una formulación en forma de polvo humectable. Además, se pudieron obtener formulaciones de polvo humectable de la misma forma, usando los respectivos compuestos que se describen en la Tabla 1 a Tabla 45 en lugar del compuesto N°. I-12.

Ejemplo de Preparación 2. Formulación apta para fluir

Compuesto del Compuesto N°. I-13	20 partes
Agua	69 partes
Sulfato de poli(éter de fenilo estirenado)	4 partes
Etilenglicol	7 partes

10 A los componentes anteriores, se añadieron silicona AF-118 N (fabricada en Asahi Kasei Corp.) en una cantidad de 200 ppm basados en la cantidad total, y se mezcló la mezcla durante 30 minutos en un agitador a velocidad elevada y se pulverizó en un pulverizador de tipo húmedo, para obtener una formulación apta para fluir. Además, las formulaciones aptas para fluir se pueden obtener de la misma forma, usando los respectivos compuestos descritos en la Tabla 1 a Tabla 45 en lugar del compuesto N°. I-13.

Ejemplo de Preparación 3. Concentrado apto para emulsión

Compuesto del Compuesto N°. I-59	30 partes
Mezcla de cantidades iguales de xileno e isoforona	60 partes
Poli(alquilato de oxietilen sorbitán)	4 partes
Poli(éter de oxietileno y alquilarilo)	4 partes

15 Se disolvieron de manera uniforme los componentes anteriores para obtener concentrado apto para emulsión. Además, se pudieron obtener emulsiones de la misma forma, usando los respectivos compuestos que se describen en la Tabla 1 a Tabla 45 en lugar del compuesto N°. I-59.

Ejemplo de Preparación 4. Formulación de gránulos

Compuesto del Compuesto N°. I-58	10 partes
Mezcla de talco y bentonita	80 partes
Carbono blanco	5 partes
Poli(alquilato de oxietilen sorbitán)	2 partes
Poli(éter de oxietileno y alquilarilo)	2 partes
Sulfonato de alquilarilo	1 parte

20 Se mezclaron los componentes anteriores y se pulverizaron. A esta mezcla, se añadió agua en una cantidad equivalente a 10 partes y se amasó la mezcla resultante. Se sometió a extrusión la mezcla amasada a través de un orificio que tenía un diámetro de 0,7 mm usando un granulador de tipo extrusión, se secó y posteriormente se cortó hasta una longitud de 0,5 a 1 mm, para obtener una formulación granular. Además, se pueden obtener formulaciones de gránulo de la misma forma, usando los respectivos compuestos descritos en la Tabla 1 a Tabla 45 en lugar del compuesto del Compuesto N°. I-58.

Los compuestos que se describen en las Tablas 1 a 45 se pueden formular para dar lugar a varias formulaciones de la misma forma de acuerdo con los procedimientos descritos en los Ejemplos de Preparación 1 a 4.

En lo sucesivo, se describe la actividad herbicida del compuesto de la presente invención con referencia a los Ejemplos de Ensayo.

Ejemplo de Ensayo 1. Ensayo para los efectos herbicidas en el tratamiento de suelos de arrozales

- 5 Se llenó un recipiente de plástico de 100 cm² con suelo de arrozal. Tras afinado y nivelado, se sembraron semillas de *Echinochloa oryzicola* Vasing, *Monochoria vaginalis* (Burm. f) Presl var. *plantaginea* (Roxb.) Solms-Laub y *Scirpus juncoides* Roxb. var. *ohwianus* T. Koyama, y se sobresaturó con agua el suelo hasta una profundidad de agua de 3 cm. Al día siguiente, se diluyó con agua una formulación de polvo humectable preparada de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 1 y se añadió gota a gota sobre la superficie del agua. La cantidad de aplicación fue una cantidad equivalente a 1000 g del ingrediente activo por hectárea. Posteriormente, se cultivaron las plantas en invernadero y al día 21 después del tratamiento, se investigaron los efectos herbicidas de acuerdo con los criterios descritos en la
- 10 Tabla 138.

[Tabla 138]

Índice Nº.	Efectos herbicidas (del grado de supresión del crecimiento) y fitotoxicidad
5	90 % o más de efectos herbicidas de supresión, fitotoxicidad
4	70 % o más y menos que 90 % de efectos herbicidas, fitotoxicidad
3	50 % o más y menos que 70 % de efectos herbicidas, fitotoxicidad
2	30 % o más y menos que 50 % de efectos herbicidas, fitotoxicidad
1	10 % o más y menos que 30 % de efectos herbicidas, fitotoxicidad
0	0 % o más y menos que 10 % de efectos herbicidas, fitotoxicidad

Los resultados se presentan en las siguientes Tablas 139 a 146.

[Tabla 139]

Compuesto Nº.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoriavaginalis</i> (Burm.f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
I-2	4	5	5
I-7	5	5	5
I-12	5	5	5
I-13	5	5	5
I-14	4	5	5
I-15	5	5	5
I-22	5	5	5
I-30	5	5	5
I-35	5	5	5
I-40	5	5	5
I-49	5	5	5
I-50	5	5	5
I-57	4	5	5
I-58	5	5	5
I-59	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoriavaginalis</i> (Burm.f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
I-62	5	5	5
I-65	4	5	5
I-67	4	5	5
I-68	4	5	5
I-70	5	5	5
I-72	5	5	5
I-82	5	5	5
I-88	5	5	5
I-90	5	5	5
I-91	5	5	5
I-92	4	5	5
I-93	5	5	5
I-94	5	5	5
I-99	5	5	5
I-102	5	4	5
I-103	5	5	5
I-107	4	5	5
I-111	5	5	5
I-112	5	5	5
I-113	5	5	5
I-120	4	5	5
I-125	4	5	5
I-126	4	5	5
I-131	5	5	5
I-137	5	5	5
I-139	5	5	5
I-144	5	5	5
I-145	5	5	5
I-148	5	5	5
I-149	5	5	4
I-156	5	5	5
I-158	5	5	5
I-159	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Echinochloa oryzicola Vasing	Monochoriavaginalis(Burm.f.) Presl var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub.	Scirpus juncoides Roxb. var. ohwianus. T. Koyama
I-160	5	5	5
I-163	4	5	5

[Tabla 140]

Compuesto N°.	Echinochloa oryzicola	Vasing Monochona vaginalis (Burm.f) Presl var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub.	Scirpus juncoides Roxb. var. ohwianus. T. Koyama
I-165	5	5	5
I-166	4	5	5
I-171	5	5	5
I-173	5	5	5
I-176	5	5	5
I-177	5	5	5
I-178	4	5	5
I-179	5	5	5
I-180	4	5	5
I-182	5	5	5
I-185	5	5	5
I-189	5	5	5
I-197	5	5	5
I-199	5	5	5
I-201	5	5	5
I-202	5	5	5
I-207	4	5	5
I-209	4	5	5
I-211	4	5	5
I-212	5	5	5
I-213	4	5	5
I-220	5	5	5
I-221	5	5	5
I-223	4	5	5
I-225	5	5	4
I-227	5	5	5
I-229	4	5	5

ES 2 389 320 T3

(continiuación)

Compuesto N°.	Echinochloa oryzicola	Vasing Monochona vaginalis (Burm.f) Presl var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub.	Scirpus juncoides Roxb. var. ohwianus. T. Koyama
I-230	5	5	5
I-238	5	4	5
I-263	5	5	5
I-264	4	5	5
I-265	4	5	5
I-266	5	5	5
I-267	5	5	5
I-268	5	5	5
I-269	5	5	5
I-270	5	5	5
I-271	5	5	5
I-272	5	5	5
I-273	5	5	5
I-274	5	5	4
I-276	4	5	5
I-276	5	5	5
I-277	5	5	5
I-278	4	5	5
I-279	4	5	5
I-280	5	5	5
I-281	5	5	5
I-283	4	5	5
I-363	5	5	5
I-364	4	5	5
I-368	4	5	5
I-371	5	5	5
I-372	5	5	5
I-373	5	5	5
I-379	5	5	5
I-380	4	5	5

[Tabla 141]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoriavaginalis</i> (Burm.f.) Presl var. <i>clantaginea</i> (Roxb) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-1	5	5	5
II-4	5	5	5
II-5	5	5	5
II-6	5	5	5
II-7	5	5	5
II-8	5	5	5
II-9	5	5	5
II-11	5	5	5
II-13	5	5	5
II-14	5	5	5
II-15	5	5	5
II-20	5	5	5
II-21	5	5	5
II-23	5	5	5
II-24	5	5	5
II-29	5	5	5
II-33	5	5	5
II-39	5	5	5
II-44	5	5	5
II-51	5	5	5
II-52	5	5	5
II-57	5	5	5
II-62	5	5	5
II-63	5	5	5
II-64	5	5	4
II-68	5	5	5
II-69	5	5	5
II-71	4	5	5
II-74	5	5	5
II-75	5	5	5
II-81	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm.f.) Presl var. <i>clantaginea</i> (Roxb) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-84	5	5	5
II-90	5	5	5
II-95	5	5	5
II-101	5	5	5
II-116	5	5	5
II-121	4	5	5
II-122	5	5	5
II-124	4	5	5
II-125	5	5	5
II-129	5	5	5
II-130	5	5	5
II-131	5	5	5
II-136	5	5	5
II-137	5	5	5
II-140	5	5	4
II-149	5	5	5
II-167	5	5	5
II-168	5	5	5
II-169	5	5	5

[Tabla 142]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-173	5	5	5
II-174	5	5	5
II-175	4	5	5
II-177	4	5	5
II-178	4	5	5
II-179	4	5	5
II-180	5	5	5
II-185	4	5	5
II-186	4	5	5

(continuación)

Compuesto Nº.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-187	5	5	5
II-188	5	5	5
II-189	5	5	5
II-190	5	5	5
II-193	5	5	5
II-194	4	5	5
II-195	5	5	5
II-196	4	5	5
II-197	5	5	5
II-208	5	5	5
II-209	5	5	5
II-210	5	5	5
II-211	5	5	5
II-212	5	5	5
II-213	5	5	5
II-214	5	5	5
II-215	5	5	5
II-216	5	5	5
II-217	4	5	5
II-218	4	5	5
II-219	5	5	5
II-220	5	5	5
II-221	4	5	5
II-222	5	5	5
II-223	5	5	5
II-224	4	5	5
II-225	5	5	5
II-226	5	5	5
II-227	5	5	5
II-228	5	5	5
II-229	5	5	5
II-230	4	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-231	5	5	5
II-232	4	5	5
II-233	5	5	5
II-235	4	5	5
II-236	4	5	5
II-237	5	5	5
II-238	5	5	5
II-239	5	5	5

[Tabla 143]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm.f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-240	4	5	5
II-241	5	5	5
II-242	5	5	5
II-243	5	5	5
II-244	5	5	5
II-245	5	5	5
II-246	4	5	5
II-247	4	5	5
II-248	5	5	5
II-249	5	5	5
II-252	5	5	5
II-253	5	5	5
II-254	5	5	5
II-256	5	5	5
II-256	5	5	5
II-257	5	5	5
II-258	4	5	5
II-259	4	5	5
II-260	5	5	5
II-261	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm.f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-263	5	5	5
II-301	5	5	5
II-303	5	5	5
II-304	5	5	5
II-305	5	5	5
II-306	5	5	5
III-2	5	5	5
III-5	5	5	5
III-7	5	5	5
III-12	5	5	5
III-13	5	5	5
III-15	5	5	5
III-30	4	5	5
III-35	4	5	5
III-40	5	5	5
III-45	4	5	5
III-59	5	5	5
III-70	4	5	5
III-88	5	5	4
III-90	5	5	5
III-96	5	5	5
III-99	5	5	5
III-107	5	5	5
III-108	5	5	5
III-111	5	5	5
III-117	5	5	5
III-118	5	5	5
III-120	5	5	5
III-130	5	5	5
III-139	5	5	5
III-158	5	5	5
III-173	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm.f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
III-189	5	5	5
III-201	5	5	5

[Tabla 144]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoriavaginalis</i> (Burm.f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> T. Koyama
III-202	5	5	5
III-207	5	5	5
III-209	5	5	5
III-212	4	5	5
III-213	4	5	5
III-220	5	5	5
III-221	4	5	5
III-229	5	5	5
III-230	5	5	5
III-231	5	5	5
III-232	5	5	5
III-234	5	5	5
III-235	5	5	5
III-236	5	5	5
III-237	5	5	5
III-238	4	5	5
III-239	4	5	5
III-240	4	5	5
III-241	5	5	5
III-242	5	5	5
III-243	5	5	5
III-244	4	5	5
III-245	4	5	5
III-246	5	5	5
III-247	5	5	5
IV-1	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm.f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> T. Koyama
IV-2	5	5	5
IV-3	5	5	5
IV-4	5	5	5
IV-6	4	5	5
IV-7	5	5	5
IV-8	5	5	5
IV-9	5	5	5
IV-11	5	5	5
IV-13	5	5	5
IV-17	5	5	5
IV-18	5	5	5
IV-19	5	5	5
IV-20	5	5	5
IV-21	5	5	5
IV-23	5	5	5
IV-24	5	5	5
IV-30	5	5	5
IV-33	5	5	5
IV-34	5	5	5
IV-39	5	5	5
IV-40	5	5	5
IV-41	5	5	5
IV-44	5	5	5

[Tabla 145]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginal</i> (Burm. f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-62	5	5	5
IV-57	4	5	5
IV-62	5	5	5
IV-85	5	5	5
IV-90	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginal</i> (Burm. f) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-95	5	5	5
IV-100	5	5	5
IV-101	5	5	5
IV-106	5	5	5
IV-128	5	5	5
IV-136	5	5	5
IV-150	5	5	5
IV-151	5	5	5
IV-152	5	5	5
IV-153	5	5	5
IV-154	5	5	5
IV-155	5	5	5
IV-156	5	5	5
IV-157	5	5	5
IV-158	5	5	5
IV-159	5	5	5
IV-160	5	5	5
IV-161	5	5	5
IV-165	4	5	5
IV-166	5	5	5
IV-168	5	5	5
IV-169	4	5	5
IV-170	5	5	5
IV-173	4	5	5
IV-174	6	5	5
IV-177	5	5	5
IV-178	5	5	5
IV-179	5	5	5
IV-180	5	5	5
IV-184	5	5	5
IV-185	5	5	5
IV-186	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginal</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-187	5	5	5
IV-188	5	5	5
IV-189	5	5	5
IV-200	5	5	5
IV-201	5	5	5
IV-202	5	5	5
IV-203	5	5	5
IV-206	5	5	5
IV-208	5	5	5
IV-209	5	5	5
IV-210	5	5	5
IV-212	5	5	5
IV-213	5	5	5
IV-214	5	5	5

[Tabla 146]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-215	5	5	5
IV-216	5	5	5
IV-217	5	5	5
IV-218	5	5	5
IV-219	5	5	5
IV-220	5	5	5
IV-221	5	5	5
IV-222	5	5	5
IV-223	5	5	5
IV-224	5	5	5
IV-225	5	5	5
IV-226	5	5	5
IV-227	5	5	5
IV-228	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-229	5	5	6
IV-230	5	5	5
IV-231	5	5	5
IV-232	5	5	5
IV-233	5	5	5
IV-234	5	5	5
IV-235	5	5	5
IV-236	5	5	5
IV-237	5	5	5
IV-238	5	5	5
IV-239	5	5	5
IV-240	5	5	5
IV-241	5	5	5
IV-242	4	5	5
IV-243	5	5	5
IV-244	5	5	5
IV-245	5	5	5
IV-247	5	5	5
IV-248	5	5	5
IV-249	5	5	5
IV-250	3	5	5
IV-251	5	5	5
IV-252	5	5	5
IV-253	5	5	5
IV-254	5	5	5
IV-255	5	5	5
IV-256	5	5	5
IV-257	5	5	5
IV-258	5	5	5
IV-259	5	5	5

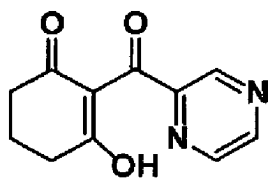
(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-260	5	5	5
IV-262	4	5	5
IV-265	5	5	5
IV-266	5	5	5
IV-267	5	5	5
IV-268	5	5	5
IV-269	5	5	5
IV-270	5	5	5
IV-271	5	5	5
Compuesto Comparativo A	2	0	0
Compuesto Comparativo B	0	0	0
Compuesto Comparativo C	1	2	1
Compuesto Comparativo D	1	4	2

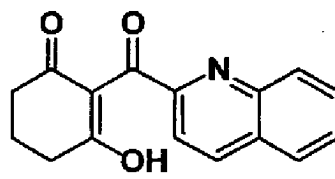
De manera adicional, el compuesto comparativo A, compuesto comparativo B, compuesto comparativo C y compuesto comparativo D de las tablas son el Compuesto N°. 70, Compuesto N°. 34, Compuesto N°. 32 y Compuesto N°. 31 descritos en el documento EP 283261, respectivamente. Las fórmulas estructurales de los

5

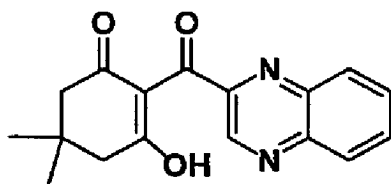
[Fórmula Química 35]



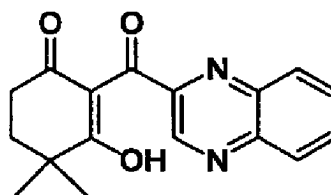
Compuesto Comparativo A



Compuesto Comparativo B



Compuesto Comparativo C



Compuesto Comparativo D

Ejemplo de Ensayo 2. Ensayo para los efectos herbicidas en el tratamiento de suelos de terrenos elevados

5 Se llenó un recipiente de plástico de 80 cm² con suelo de un terreno elevado. Se sembraron semillas de *Amaranthus viridis* L. y se cubrió el suelo. Se diluyó con agua una formulación de polvo humectable preparada de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 1 y se pulverizó de manera uniforme sobre la superficie del suelo con un pulverizador de pequeño tamaño. Posteriormente, se cultivaron las plantas en invernadero y al día 21 después del tratamiento, se investigaron los efectos herbicidas de acuerdo con los criterios descritos en la Tabla 138 mostrada anteriormente. Los resultados se presentan en las Tablas 147 a 154.

[Tabla 147]

Compuesto N°.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
I-2	5	5
I-5	5	5
I-7	5	5
I-12	5	5
I-13	5	5
I-14	5	5
I-15	5	5
I-18	5	5
I-21	5	5
I-30	5	5
I-40	5	5
I-49	5	5
I-50	5	5
I-57	4	5
I-58	5	5
I-59	5	5
I-62	5	5
I-65	5	5
I-68	5	5
I-70	5	5
I-71	5	5
I-72	5	5
I-80	5	5
I-82	5	5
I-88	5	5
I-90	5	5
I-93	4	5
I-94	5	4

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-99	5	5
I-102	5	5
I-103	5	5
I-107	5	5
I-131	5	5
I-139	5	5
I-144	5	5
I-145	5	5
I-148	5	5
I-149	5	5
I-156	5	5
I-158	5	5
I-159	5	5
I-160	5	5
I-163	5	5
I-165	5	5
I-171	5	5
I-173	5	5
I-176	5	5
I-177	5	5
I-178	5	5
I-179	5	5

[Tabla 148]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-180	5	5
I-182	5	5
I-185	5	5
I-189	5	5
I-195	5	5
I-197	5	5
I-199	5	5
I-201	4	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-202	4	5
I-207	5	5
I-209	4	5
I-211	5	5
I-212	5	5
I-213	5	5
I-220	5	5
I-221	5	5
I-223	5	5
I-225	5	5
I-227	5	5
I-229	5	5
I-230	4	5
I-238	5	4
I-256	5	5
I-263	5	5
I-264	4	5
I-265	4	5
I-266	5	5
I-267	5	5
I-26S	5	5
I-269	5	5
I-270	5	5
I-271	5	5
I-272	5	5
I-273	5	5
I-275	4	5
I-277	4	5
I-278	5	5
I-279	5	5
I-281	5	5
I-283	5	5
I-363	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-364	5	5
I-368	5	5
I-371	5	5
I-372	5	5
I-373	5	5
I-379	5	5
I-380	5	5
II-1	5	5
II-4	4	5
II-5	5	5
II-6	5	5
II-7	5	5
II-8	5	5
II-9	5	4
II-11	5	5

[Tabla 149]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-13	5	5
II-14	5	5
II-15	5	5
II-20	5	5
II-21	5	5
II-23	5	5
II-24	5	5
II-29	4	5
II-33	4	5
II-39	5	5
II-44	5	5
II-52	5	5
II-57	5	5
II-62	5	5
II-63	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-64	4	5
II-68	5	5
II-69	4	5
II-75	4	5
II-81	5	5
II-90	5	5
II-95	5	5
II-101	5	5
II-122	5	5
II-125	5	5
II-129	5	5
II-130	5	5
II-131	5	5
II-136	5	5
II-137	5	5
II-146	4	5
II-149	4	5
II-167	5	5
II-168	5	5
II-173	4	5
II-174	4	5
II-180	4	5
II-185	5	5
II-186	5	5
II-188	5	5
II-189	5	5
II-190	5	4
II-193	5	5
II-194	4	5
II-196	4	5
II-208	5	5
II-211	5	5
II-212	5	5
II-213	5	5

[Tabla 150]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-215	5	5
II-216	4	5
II-217	5	5
II-218	5	5
II-219	5	5
II-220	5	5
II-221	4	5
II-222	5	5
II-223	4	5
II-224	5	5
II-225	5	5
II-226	5	5
II-227	5	5
II-228	5	5
II-229	4	5
II-230	4	5
II-231	4	5
II-232	4	5
II-233	5	5
II-234	5	5
II-235	4	5
II-236	4	5
II-237	5	5
II-238	5	5
II-239	5	5
II-240	5	5
II-241	5	5
II-242	4	5
II-243	5	5
II-244	5	5
II-245	5	5
II-247	5	5
II-249	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-250	5	5
II-252	5	5
II-254	4	5
II-259	5	5
II-260	5	5
II-261	4	5
II-262	4	5
II-263	4	5
II-301	5	5
II-302	4	5
II-303	5	5
II-304	5	5
II-305	5	5
II-306	5	5
III-2	5	5
III-5	5	4
III-7	5	5
III-12	4	5
III-13	5	5
III-15	5	5
III-30	5	5

[Tabla 151]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
III-35	5	5
III-40	5	5
III-45	4	5
III-59	5	5
III-70	5	5
III-88	5	5
III-90	5	5
III-96	5	5
III-99	5	5
III-107	4	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
III-108	5	5
III-111	5	5
III-117	5	5
III-118	5	5
III-120	4	5
III-130	5	5
III-139	5	5
III-158	5	5
III-173	5	5
III-189	5	5
III-201	5	5
III-202	5	5
III-207	5	5
III-209	5	5
III-212	4	5
III-213	5	5
III-220	5	4
III-221	4	5
III-229	5	5
III-231	5	5
III-232	5	5
III-233	5	5
III-234	5	5
III-236	5	5
III-237	5	5
III-238	5	5
III-239	5	5
III-240	5	5
III-242	4	5
III-243	5	5
III-244	5	5
III-245	5	5
III-246	4	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
III-247	4	5
IV-1	5	5
IV-2	5	5
IV- 3	5	5
IV-4	5	5

[Tabla 152]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-6	5	5
IV-7	5	5
IV-8	5	5
IV-9	5	5
IV-11	5	5
IV-13	5	5
IV 17	5	5
IV-18	5	5
IV-19	5	5
IV-20	5	5
IV-21	5	5
IV-23	5	5
IV-24	5	5
IV-30	4	5
IV-33	5	5
IV-34	5	5
IV-39	5	5
IV-40	5	5
IV-41	5	5
IV-44	5	5
IV-52	5	5
IV-57	5	4
IV-62	5	5
IV-85	5	5
IV-90	5	5

(Continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-95	5	5
IV-100	5	5
IV-101	5	5
IV- 106	5	5
IV-128	5	5
IV-136	5	5
IV-150	5	5
IV-151	5	5
IV-152	5	5
IV-153	5	5
IV-154	5	5
IV-155	5	5
IV-156	5	5
IV-157	5	5
IV-158	5	5
IV-159	5	5
IV-160	5	5
IV-161	5	5
IV-165	5	5
IV-166	5	5
IV- 168	5	5
IV-169	5	5
IV- 170	5	5

[Tabla 153]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-173	5	5
IV-177	5	5
IV-178	5	5
IV-179	5	5
IV-180	4	5
IV-184	5	5
IV-186	5	5
IV-187	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-188	5	5
IV-189	5	4
IV-200	5	5
IV-201	5	5
IV-202	5	5
IV-203	5	5
IV-206	5	5
IV-208	5	5
IV 209	5	5
IV-210	5	5
IV-212	5	5
IV-213	5	5
IV-214	5	5
IV-215	5	5
IV-216	5	5
IV-217	5	5
IV-218	5	5
IV-219	5	5
IV-220	5	5
IV-221	5	5
IV-222	5	5
IV-223	5	5
IV-224	5	5
IV-225	5	5
IV-226	5	5
IV-227	5	5
IV-228	5	5
IV-229	5	5
IV-230	5	5
IV-231	5	5
IV-232	5	5
IV-233	5	5
IV-234	5	5
IV-235	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-236	5	5
IV-237	5	5
IV-238	5	5
IV-239	4	5
IV-240	5	5
IV- 241	4	5
IV- 242	5	5
IV- 243	5	5

[Tabla 154]

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-244	5	5
IV-245	5	5
IV-247	5	5
IV-248	5	5
IV-249	4	5
IV-250	4	5
IV-251	4	5
IV-252	5	5
IV-253	5	5
IV-254	5	5
IV-255	5	5
IV-256	5	5
IV-257	5	5
IV-258	5	5
IV-259	5	5
IV-260	5	5
IV-262	5	5
IV-266	5	5
IV-267	5	5
IV-268	5	5
IV-269	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-271	4	5
Compuesto Comparativo	A	0
Compuesto Comparativo	B 2	2
Compuesto Comparativo	C 0	3
Compuesto Comparativo	D 0	3

De manera adicional, el compuesto comparativo A, el compuesto comparativo B, el compuesto comparativo C y el compuesto comparativo D de las Tablas son los Compuestos Nos. 70, 34, 32 y 31 que se describen en el documento EP-283261, respectivamente. De manera adicional, el compuesto comparativo A y el compuesto comparativo B de las Tablas son los Compuesto N°. 70 y Compuesto N°. 34 descritos en el documento EP-283261, respectivamente.

Ejemplo de Ensayo 3. Ensayo sobre los efectos herbicidas en el tratamiento foliar de terrenos elevados

Se llenó un recipiente de plástico de 80 cm² con suelo de un terreno elevado. Se sembraron semillas de Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var crus-galli, Abutilon theophrasti medicus y Amaranthus viridis L., y se cultivaron las plantas durante dos semanas en invernadero. Se diluyó con agua una formulación en forma de polvo humectable preparada de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 1, y se pulverizó con un dispositivo de pulverización de pequeño tamaño para llevar a cabo la aplicación aérea foliar sobre todas las plantas desde el lado superior en un cantidad equivalente a 1000 litros por hectárea, de forma que se aplicaron 1000 g del ingrediente activo. Posteriormente, se cultivaron las plantas en invernadero, y en el día 14th después del tratamiento, se investigaron los efectos herbicidas de acuerdo con los criterios descritos en la Tabla 138 mostrada anteriormente. Los resultados se presentan en la siguiente Tabla 155 a 162.

[Tabla 155]

Compuesto N°.	Echinochloa crus-galli(L.)P. Beauv-var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-2	4	5	5
I-5	4	5	5
I-7	4	5	5
I-12	4	5	5
I-13	5	5	5
I-14	4	5	5
I-15	5	5	5
I-21	5	5	5
I-22	4	5	5
I-30	4	5	5
I-35	4	5	5
I-40	5	5	5
I-49	4	5	5
I-50	4	5	5

(continuación)

Compuesto Nº.	Echinochloacrus-galli(L.)P. Beauv-var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
1-58	5	5	5
I-59	5	5	5
I-62	5	5	5
I-65	4	5	5
I-67	4	5	5
I-68	4	5	5
I-70	5	5	5
I-71	5	5	5
I-72	5	5	5
I-82	4	5	5
I-88	5	5	5
I-90	5	5	5
I-91	5	5	5
I-92	5	5	5
1-93	5	5	5
I-94	5	5	5
I-99	5	5	5
I-100	5	4	5
I-102	5	5	5
I-103	5	5	5
I-107	4	5	5
I-111	5	5	5
I-112	4	5	5
I-131	5	5	5
I-136	4	5	5
I-137	4	5	5
I-139	4	5	5
I-144	5	5	5
I-145	5	5	5
I-148	5	5	5
I-149	5	5	5
I-156	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Echinochloa crus-galli(L.)P. Beauv-var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-158	5	5	5
I-159	4	5	5
I-160	5	5	5
I-163	4	5	5

[Tabla 156]

Compuesto N°.	Echinochloa crus galli (L.) P. Beauv. var crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
I-171	5	5	5
I-173	5	5	5
I-176	5	5	5
I-177	5	5	5
I-179	5	5	5
I-180	4	5	5
I-182	5	5	5
I-185	5	5	5
I-189	4	5	5
I-195	5	5	5
I-197	5	5	5
I-199	5	5	5
I-201	5	4	5
I-202	4	5	5
I-207	5	5	5
I-211	5	5	5
I-212	5	4	5
I-213	5	5	5
I-220	5	5	5
I-221	4	5	5
I-225	4	5	5
I-227	4	5	5
I-229	4	5	5
I-230	5	5	5
I-243	5	5	5
I-247	4	5	5
I-263	5	5	5

(Continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa crus galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
I-266	5	5	5
I-267	5	5	5
I-268	5	5	5
I-269	5	5	5
I-270	5	5	5
I-271	5	5	5
I-272	5	5	5
I-275	5	4	5
I-277	5	5	5
I-281	5	5	5
I-283	4	5	5
I-364	5	5	5
I-371	5	5	5
I-372	4	5	5
I-373	5	5	5
I-380	4	5	5
II-1	5	5	5
II-4	4	5	5
II-5	5	5	5
II-6	5	5	5
II-7	5	5	5
II-8	5	5	5
II-9	5	5	5
II-11	5	5	5
II-13	5	5	5

[Tabla 157]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
II-14	5	4	5
II-15	5	5	5
II-20	5	5	5
II-21	5	5	5
II-23	5	5	5

(continuación)

Compuesto Nº.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-24	5	4	5
II-33	5	5	5
II-39	5	5	5
II-44	5	5	5
II-51	4	5	5
II-52	5	5	5
II-57	5	5	5
II-62	4	5	5
II-63	5	4	5
II-64	5	5	5
II-68	5	5	5
II-69	5	5	5
II-71	4	5	5
II-74	3	4	4
II-75	5	4	5
II-84	4	4	5
II-90	5	5	5
II-95	5	5	5
II-101	5	5	5
II-116	4	4	5
II-121	4	4	4
II-122	5	4	5
II-124	5	4	5
II-125	5	5	5
II-129	5	5	5
II-130	5	5	5
II-131	5	5	5
II-136	5	5	5
II-137	5	5	5
II-149	5	5	5
II-167	5	5	5
II-168	4	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
II-173	4	5	5
II-178	5	5	5
II-185	4	5	5
II-188	4	5	5
II-189	5	5	5
II-190	4	5	5
II-196	5	5	5
II-197	5	4	5
II-208	4	5	5
II-210	4	5	5
II-211	5	5	5

[Tabla 158]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.)P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
II-212	5	5	5
II-213	4	5	5
II-214	5	5	5
II-215	5	5	5
II-217	4	5	5
II-218	4	5	5
II-219	5	5	5
II-220	5	5	5
II-221	5	5	5
II-222	5	5	5
II-223	5	5	5
II-224	5	5	5
II-225	5	5	5
II-226	5	5	5
II-227	5	4	5
II-228	5	5	5
II-231	5	5	5
II-233	6	5	5

(continuación)

Compuesto Nº.	Echinochloa crus-galli (L.)P. Beauv. var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-234	4	5	5
II-237	5	5	5
II-238	5	5	5
II-239	4	5	5
II-241	5	5	5
II-242	5	4	5
II-243	5	5	5
II-244	5	5	5
II-249	5	5	5
II-252	5	5	5
II-254	5	4	5
II-255	5	4	5
II-256	5	4	5
II-257	5	4	5
II-260	5	5	5
II-261	5	5	5
II-263	5	4	5
II-303	5	5	5
II-304	4	5	5
II-305	5	5	5
III-2	5	5	5
III-5	5	5	5
III-7	4	5	5
III-12	4	5	5
III-13	4	5	5
III-15	5	5	5
III-30	4	5	5
III-35	4	5	5
III-40	4	5	5
III-45	5	5	5
III-59	5	5	5
III-88	5	5	5

[Tabla 159]

Compuesto Nº.	Echinochia crus-galli (L.) P. Beauv. var crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
III-90	5	5	5
III-96	5	5	5
III-99	4	5	5
III-107	4	5	5
III-108	5	5	5
III-111	5	5	5
III-117	5	5	5
III-118	5	5	5
III-120	5	5	5
III-130	5	5	5
III-139	4	5	5
III-158	5	5	5
III-173	5	5	5
III-189	5	5	5
III-201	5	5	5
III-202	5	5	5
III-207	5	5	5
111-209	5	5	5
III-212	5	5	5
III-213	4	5	5
III-221	4	5	5
111-229	5	5	5
III-230	5	5	5
III-231	5	5	5
III-232	5	5	5
III-234	5	5	5
III-235	5	5	5
III-236	4	5	5
III-237	5	5	5
III-238	5	5	5
III-239	4	5	5
III-240	4	5	5

(Continuación)

Compuesto N°.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
III-241	4	5	5
III-242	5	5	5
III-243	5	5	5
III-246	5	5	5
III-247	5	5	5
IV-1	5	5	5
IV-2	5	5	5
IV-3	5	5	5
IV-4	5	5	5
IV-6	4	5	5
IV-7	5	5	5
IV-8	5	5	5
IV-9	5	5	5
IV-11	5	5	5
IV-13	5	5	5

[Tabla 160]

Compuesto N°.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
IV-17	5	5	5
IV-18	5	5	5
IV-19	5	5	5
IV-20	5	5	5
IV-21	5	5	5
IV-23	5	4	5
IV-24	5	4	5
IV-30	5	4	5
IV-33	5	5	5
IV-34	5	5	5
IV-39	5	5	5
IV-40	6	5	5
IV-41	5	5	5
IV-44	5	5	5
IV-52	5	5	5

(continuación)

Compuesto Nº.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var cus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-57	4	5	5
IV-62	5	5	5
IV-85	5	5	5
IV-90	5	5	5
IV-95	5	5	5
IV-100	5	5	5
IV-101	5	5	5
IV-106	5	5	5
IV-128	5	5	5
IV-136	5	5	5
IV-150	5	5	5
IV-151	5	5	5
IV-152	5	5	5
IV-153	4	5	5
IV-154	5	5	5
IV-155	5	5	5
IV-156	5	5	5
IV-157	4	5	5
IV-158	5	5	5
IV-160	5	5	5
IV-161	5	5	5
IV-165	5	5	5
IV-166	5	5	5
IV-168	5	5	5
IV-169	5	5	5
IV-173	5	5	5
IV-174	4	5	5
IV-177	4	5	5
IV-178	5	5	5
IV-179	5	4	5
IV-180	5	5	5
IV-184	5	5	5

[Tabla 161]

Compuesto Nº.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-186	5	4	5
IV-186	5	5	5
IV-187	5	5	5
IV-188	5	5	5
IV-189	5	5	5
IV-200	5	5	5
IV-201	5	5	5
IV-202	5	5	5
IV-203	5	5	5
IV-206	5	5	5
IV-208	5	4	5
IV-209	5	5	5
IV-210	5	5	5
IV-212	5	5	5
IV-213	5	5	5
IV-214	5	5	5
IV-215	5	5	5
IV-216	5	5	5
IV-217	5	5	5
IV-218	5	5	5
IV-219	5	5	5
IV-220	5	5	5
IV-221	5	5	5
IV-222	5	5	5
IV-223	5	5	5
IV-224	5	5	5
IV-225	5	5	5
IV-226	5	5	5
IV-227	5	5	5
IV-228	5	5	5
IV-229	5	5	5
IV-230	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-231	5	5	5
IV-232	5	5	5
IV-233	5	5	5
IV-234	5	5	5
IV-235	5	5	5
IV-236	5	5	5
IV-237	5	5	5
IV-238	5	5	5
IV-239	5	5	5
IV-240	5	5	5
IV-241	5	4	5
IV-242	5	5	5
IV-243	5	5	5
IV-244	5	5	5
IV-245	5	5	5
IV-247	5	5	5
IV-248	5	5	5

[Tabla 162]

Compuesto N°.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-251	5	4	5
IV-252	5	5	5
IV-253	5	5	5
IV-254	5	5	5
IV-255	5	5	5
IV-256	5	5	5
IV-257	4	5	5
IV-258	5	5	5
IV-259	5	5	5
IV-260	4	5	5
IV-262	4	5	5
IV-266	5	5	5

(continuación)

Compuesto N°.	Echinochloa crus-galli(L.)P. Beauv. var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-267	4	5	5
IV-268	5	5	5
IV-269	5	5	5
IV-271	5	5	5
Compuesto Comparativo A	0	2	1
Compuesto Comparativo B	0	5	1
Compuesto Comparativo C	0	4	0
Compuesto Comparativo D	0	4	1

De manera adicional, el compuesto comparativo A, el compuesto comparativo B, el compuesto comparativo C y el compuesto comparativo D de las Tablas son los Compuestos Nos. 70, 34, 32 y 31 descritos en el documento EP-283261, respectivamente.

A partir de los resultados anteriores, se ha demostrado que el compuesto de la presente invención presenta una excelente actividad herbicida.

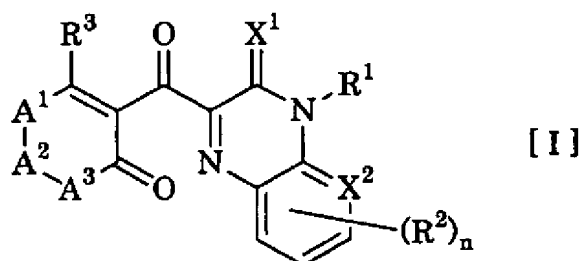
Aplicabilidad Industrial

La presente invención es para proporcionar un nuevo compuesto que tiene una excelente actividad herbicida, y por tanto, la invención es útil en los campos de agroquímica y agricultura, y tiene aplicabilidad industrial

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de oxopirazina representado por medio de la fórmula [I] o una de sus sales aceptables agroquímicamente:

[Fórmula Química 36]



- 5 en la que X¹ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
X² representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²) o N(O)_m;
m representa un número entero de 0 ó 1;
R¹ representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆;
un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo
10 haloalqueno C₂-C₆; un grupo haloalquino C₂-C₆; un grupo halocicloalquilo C₃-C₈; un grupo halocicloalquil C₃-C₈-
alquilo C₁-C₆; un grupo aminoalquilo C₁-C₆; un grupo nitroalquilo C₁-C₆; un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino alquilo
C₁-C₆; un grupo di(alquil C₁-C₆)aminoalquilo C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-
C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo
15 haloalquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-
C₆; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo fenilalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ (el resto fenilo del grupo puede estar
sustituido con uno o más de R⁴ idénticos o diferentes); un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo
20 cicloalquiloxi C₃-C₈-alquilo C₁-C₆; un grupo cicloalquil C₃-C₈-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆
(el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o más de R⁴ idénticos o diferentes); un grupo
heterocicloalquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos
escogidos entre oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (un resto heterocíclico que tiene de 2 a 10
25 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de
azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁵ idénticos o
diferentes); un grupo feniltioalquilo C₁-C₆ (el resto fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁴
idénticos o diferentes); un grupo fenilsulfonilalquilo C₁-C₆ (un grupo fenilo del grupo puede estar sustituido con uno o
dos o más de R⁴ idénticos o diferentes); un grupo fenilsulfonilalquilo C₁-C₆ (un fenilo del grupo puede estar sustituido
30 con uno o dos o más de R⁴ idénticos o diferentes); un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo heterocíclico
alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5
heteroátomos que se escogen entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto
heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de
35 oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁵
idénticos o diferentes); un grupo alquiltio C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilalcoxi C₁-C₆-alquilo
C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo
cianoalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un grupo
40 acil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo di(alcoxi C₁-C₆)alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un
grupo alcoxiiimino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilidenaminoxi- C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O)alquilo
C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀-alquilo C₁-C₆ (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸
idénticos); un grupo alquilo C₁-C₆ heterocíclico en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y
de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto
heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre átomo de oxígeno,
40 átomo de azufre y átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o
diferentes); un grupo NR¹⁰R¹¹; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo arilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o
dos o más de R¹² idénticos o diferentes); o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5
heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el grupo puede
45 estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes);
R² representa un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un
grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆;
un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo haloalquino C₂-C₆; un grupo halocicloalquilo
C₃-C₈; un grupo halocicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo cicloalquiloxi C₃-C₈; un grupo

cicloalquil C₃-C₈ alquiloxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo amino; un grupo mono(alquil C₁-C₆) amino; un grupo di(alquil C₁-C₆) amino; un grupo acilamino C₁-C₆; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoximino C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo carboxilo; un grupo alcocicarbonilo C₁-C₆; un grupo carbamoilo; un grupo mono (alquil C₁-C₆) aminocarbonilo; un grupo di(alquil C₁-C₆) aminocarbonilo; o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes); y además, dos R² adyacentes puede estar unidos a los átomos de carbono respectivos a los cuales se encuentran unidos directamente los R²s, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, y el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆ o un grupo oxo;

n representa un número entero de 0 a 4 cuando X² es CH (el grupo puede estar sustituido con R²), y n representa un número entero de 0 a 3 cuando X² es N(O)_m;

R³ representa un grupo hidroxilo; O M⁺ (en el que M⁺ es un catión de metal alcalino o un catión de amonio); un grupo amino; un átomo de halógeno; un grupo alquilsulfoniloxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alqueniltio C₂-C₆; un grupo alquenilsulfino C₂-C₆; un grupo alquenilsulfonilo C₂-C₆; un grupo alquinitio C₂-C₆; un grupo alquinilsulfino C₂-C₆; un grupo alquinilsulfonilo C₂-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆; un grupo alquenilcarboniloxi C₂-C₆; un grupo alquinilcarboniloxi C₂-C₆; un grupo fenoxi (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes); un grupo feniltio (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes), es decir, un grupo fenilitio que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes; un grupo fenilsulfino (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes); un grupo fenilsulfoniloxi (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes); un grupo fenilcarboniloxi (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹⁴ idénticos o diferentes); un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo; un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo; un grupo 1,2,3-triazol-2-ilo; un grupo imidazol-1-ilo; un grupo pirazol-1-ilo; un grupo tetrazol-1-ilo; o un grupo tetrazol-2-ilo.

R⁴ representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocicarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R⁵ representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocicarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R⁶ y R⁷ representan cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o R⁶ y R⁷ pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual éstos se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo puede presentar un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R⁶ y R⁷.

R⁸ representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocicarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R⁹ representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo nitro, un grupo ciano; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alqueniloxi C₂-C₆; un grupo alquiniloxi C₂-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆; un grupo alquilsulfino C₁-C₆; un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo haloalquiltio C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfino C₁-C₆; un grupo haloalquilsulfonilo C₁-C₆; un grupo alcocicarbonilo C₁-C₆; un grupo acilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C<

presentar un átomo de azufre y/o oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R^{10} y R^{11} ;

R^{12} representa un átomo de halógeno; un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenilo C_2-C_6 ; un grupo halocicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo halocicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cicloalquiloxi C_3-C_8 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfino C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfino C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo amino; un grupo acilamino C_1-C_6 ; un grupo mono(alquil C_1-C_6)amino; un grupo di(alquil C_1-C_6)amino; un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoximino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; un grupo carbamoilo; un grupo mono(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo; un grupo di(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo; o un grupo heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes); o un grupo heterocíclico alcoxi C_1-C_6 en el que el resto heterocíclico tiene de 2 a 10 átomos de carbono y de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno (el resto heterocíclico que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que tiene de 1 a 5 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno en el grupo, puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{14} idénticos o diferentes) o dos R^{12} adyacentes pueden estar unidos con los átomos de carbono respectivos a los cuales R^{12} se encuentran unidos directamente para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo haloalcoxi C_1-C_6 o un grupo oxo;

R^{13} representa un grupo oxi; un grupo tioxi; un grupo hidroxilo; un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenilo C_2-C_6 ; un grupo halocicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo halocicloalquil C_3-C_8 alquilo; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alqueniloxi C_2-C_6 ; un grupo alquiniloxi C_2-C_6 ; un grupo cicloalquiloxi C_3-C_8 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquiloxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfino C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfino C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo amino; un grupo mono(alquil C_1-C_6)amino; un grupo di(alquil C_1-C_6)amino; un grupo acilamino C_1-C_6 ; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; un grupo carbamoilo; un grupo mono(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo; un grupo di(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoximino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfino C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; y además dos R^{13} adyacentes pueden estar unidos junto con los respectivos átomos de carbono a los que R^{13} se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo haloalcoxi C_1-C_6 o un grupo oxo;

R^{14} representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ;

A^1 representa $C(R^{15}R^{16})$;

A^2 representa $C(R^{17}R^{18})$, o $C=O$;

A^3 representa $C(R^{19}R^{20})$; y

R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} y R^{20} representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 y R^{15} y R^{20} pueden estar unidos juntos para formar una cadena de alquilenos C_2-C_5 y pueden constituir un anillo junto con los átomos de carbono adyacentes.

2. El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con la reivindicación 1, en el que en la fórmula [I], X^2 es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R^2).

3. El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con la reivindicación 1, en el que en la fórmula [I], X^2 es $N(O)_m$.

4. El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con la reivindicación 1, en el que en la fórmula [I], R^3 es un grupo hidroxilo; o O^+M^+ (en el que M^+ es un catión de metal alcalino o un catión de amonio).

5. El derivado de oxipirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con la reivindicación 1 anterior, en el que en la fórmula [I],

X² es CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²) o un átomo de nitrógeno;

R¹ representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalqueno C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo fenoxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahydrofuranoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆-carboniloxialquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes); un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes); un grupo NR¹⁰R¹¹; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes); o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes)

Het¹ es tetrahydrofurano, tetrahydrotiofeno, dióxido de tetrahydrotiofeno, tetrahydrotiopirano, dióxido de tetrahydrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol;

R² es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R³ es un grupo hidroxilo;

R⁸ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ o un grupo haloalcoxi C₁-C₆;

R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆;

R¹² es un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alqueno C₂-C₆, un grupo alquinoxil C₂-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquiltio C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquinoxil C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆, un grupo di(alquil C₁-C₆);amino, o un grupo Het¹-alcoxi C₁-C₆ o dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo oxo; y

R¹³ es un grupo oxo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆; o un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino.

6. El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 4 y 5, en el que en la fórmula [I]

X² es CH (el grupo está sustituido con R²);

R¹ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahydrofuranoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxycarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes); un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes); un grupo NR¹⁰R¹¹; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes); o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes)

Het¹ es tetrahydrofurano, tetrahydrotiofeno, dióxido de tetrahydrotiofeno, tetrahydrotiopirano, dióxido de tetrahydrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,9-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol;

R² es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

R³ es un grupo hidroxilo;

R⁸ es un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C₁-C₆;

R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆;

R¹⁰ y R¹¹ son cada uno de forma independiente un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆;

R¹² es un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alqueno C₂-C₆, un grupo alquinoxil C₂-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆, un grupo haloalquiltio C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquil C₃-C₈ alquinoxil C₁-C₆, un grupo cianoalcoxi C₁-C₆, un grupo acilo C₁-C₆, un grupo alcoxycarbonilo C₁-C₆, un grupo di(alquil C₁-C₆);amino, o un grupo Het¹-alcoxi C₁-C₆ o dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran

directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo oxo; y

5 R¹³ es un grupo oxo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆; o un grupo mono(alquil C₁-C₆)amino.

7. El derivado de oxopirazina o su sal aceptable agroquímicamente de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 4, y 5 anteriores, en el que en la fórmula [I],

X¹ es un átomo de oxígeno;

10 X² es un átomo de nitrógeno;

R¹ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₁₂; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalquenilo C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcocarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆; (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes); un grupo Het²-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes); un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes); o un grupo Het² (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het² que puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes;

15 Het² es 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, piridina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol o benzo-1,4-dioxano;

20 R² es un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆;

R³ es un grupo hidroxilo;

R⁸ es un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ o un grupo haloalcoxi C₁-C₆;

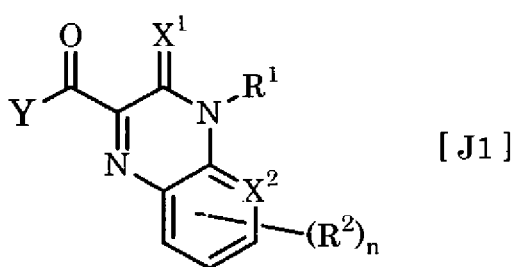
R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo C₁-C₆;

25 R¹² es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo haloalcoxi C₁-C₆ o un grupo haloalquiltio C₁-C₆, o dos R¹² adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno; y

30 R¹³ es un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆;

8. Un compuesto representado por medio de la fórmula [J1]:

[Fórmula Química 37]



en la que X¹ representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

35 X² representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R²) o un átomo de nitrógeno;

R¹ representa un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₈; un grupo haloalquilo C₁-C₆; un grupo haloalquenilo C₂-C₆; un grupo alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆; un grupo alcocarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo feniloxialquilo C₁-C₆; un grupo haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo tetrahidrofuranalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alquil C₁-C₆ sulfonilalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo cianoalquilo C₁-C₆; un grupo alquilcarboniloxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo acil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo alcocarbonil C₁-C₆ alquilo C₁-C₆; un grupo (R⁶R⁷N=C=O) alquilo C₁-C₆; un grupo aril C₆-C₁₀ alquilo C₁-C₆ (el resto arilo del grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁸ idénticos o diferentes); un grupo Het¹-alquilo C₁-C₆ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R⁹ idénticos o diferentes); un grupo NR¹⁰R¹¹; un grupo arilo C₆-C₁₀ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹² idénticos o diferentes); o un grupo Het¹ (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R¹³ idénticos o diferentes);

45 R² representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquiltio C₁-C₆, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ o un grupo alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆;

n representa un número entero de 0 a 4 cuando X^2 es CH (el grupo puede estar sustituido con R^2) y n representa un número entero de 0 a 3 cuando X^2 es un átomo de nitrógeno;

R^6 y R^7 representa cada uno de forma independiente un grupo alquilo C_1-C_6 y además R^6 y R^7 pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo presenta un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R^6 y R^7 ;

R^8 representa un átomo de halógeno; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; o un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ;

R^9 representa un grupo alquilo C_1-C_6 ; un átomo de halógeno; o un grupo haloalquilo C_1-C_6 ;

R^{10} y R^{11} representa cada uno de forma independiente un grupo alquilo C_1-C_6 o un grupo alcóxicarbonilo C_1-C_6 ;

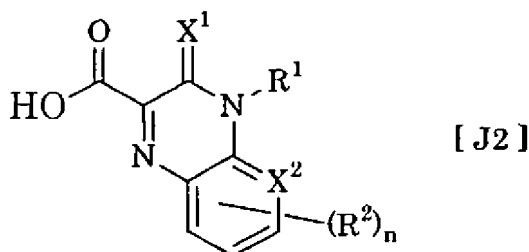
R^{12} representa un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo cicloalquilo C_3-C_8 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo alquenoiloxi C_2-C_6 , un grupo alquinoiloxi C_2-C_6 , un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , un grupo alquiltio C_1-C_6 , un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 , un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 , un grupo acilo C_1-C_6 , un grupo alcóxicarbonilo C_1-C_6 , un grupo di(alquil C_1-C_6 ;)amino, o un grupo Het^1 -alcoxi C_1-C_6 y además dos R^{12} adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 o un grupo oxo; y

R^{13} representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; o un grupo mono(alquil C_1-C_6)amino;

Y representa un átomo de halógeno o un grupo ciano; y Het^1 representa tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol.

9. Un compuesto representado por medio de la fórmula [J2]:

[Fórmula Química 38]



en la que X^1 representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X^2 representa CH (el átomo de carbono puede estar sustituido con R^2) o un átomo de nitrógeno;

R^1 representa un grupo alquinoil C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquenoil C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo feniloxialquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo tetrahidrofuranoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquil C_1-C_6 sulfonilalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo acil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcóxicarbonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo ($R^6R^7N-C=O$) alquilo C_1-C_6 ; un grupo Het^1 -alquilo C_1-C_6 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes); un grupo arilo C_6-C_{10} (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes); o un grupo Het^1 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} idénticos o diferentes), es decir, un grupo Het^1 que puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} idénticos o diferentes;

R^2 representa un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un grupo alquiltio C_1-C_6 , un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 o un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ;

n representa un número entero de 0 a 4 cuando X^2 es CH (el grupo puede estar sustituido con R^2) y n representa un número entero de 0 a 3 cuando X^2 es un átomo de nitrógeno;

R^6 y R^7 representa cada uno de forma independiente un grupo alquilo C_1-C_6 y además R^6 y R^7 pueden estar unidos junto con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, para formar un anillo de 5 a 6 miembros, mientras que el anillo formado de este modo presenta un átomo de oxígeno interpuesto, además del átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos R^6 y R^7 ;

R^9 representa un grupo alquilo C_1-C_6 ; un átomo de halógeno; o un grupo haloalquilo C_1-C_6 ;

- R^{10} y R^{11} representa cada uno de forma independiente un grupo alquilo C_1-C_6 o un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 ;
 R^{12} representa un grupo hidroxilo; un grupo nitro; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquenilo C_2-C_6 ; un grupo alquinoxilo C_2-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 ; un grupo acilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; un grupo di(alquil C_1-C_6)amino; o un grupo Het^1 -alcoxi C_1-C_6 y además dos R^{12} adyacentes se pueden unir con los respectivos átomos de carbono a los cuales se encuentran directamente unidos, para formar un anillo carbocíclico de 4 a 8 miembros o un anillo heterocíclico de 4 a 8 miembros que tiene de 1 a 4 heteroátomos escogidos entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno, mientras que el anillo formado de este modo puede estar sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 o un grupo oxo; y
 R^{13} representa un grupo oxo; un átomo de halógeno; un grupo alquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 ; o un grupo mono(alquil C_1-C_6)amino;
 Het^1 representa tetrahidrotiofeno, dióxido de tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, dióxido de tetrahidrotiopirano, 4,5-dihidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-dihidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano o indol.
10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9 anterior, en el que en la fórmula [J2],
 R^1 es un grupo alquilo C_2-C_6 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ; un grupo haloalquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalqueno C_2-C_6 ; un grupo alquiltio C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilsulfonil C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxi C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo feniloxialquilo C_1-C_6 ; un grupo haloalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo tetrahydrofuranoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alquil C_1-C_6 sulfonilalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo cianoalquilo C_1-C_6 ; un grupo alquilcarboniloxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo acil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo alcoxycarbonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; un grupo ($R^6R^7N-C=O$) alquilo C_1-C_6 ; un grupo Het^1 -alquilo C_1-C_6 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^9 idénticos o diferentes); un grupo $NR^{10}R^{11}$; o un grupo Het^1 (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{13} idénticos o diferentes).
11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9 anterior, en el que en la fórmula [J2],
 X^2 representa un átomo de nitrógeno, y
 R^1 es un grupo arilo C_6-C_{10} (el grupo puede estar sustituido con uno o dos o más de R^{12} idénticos o diferentes).
12. Un herbicida que comprende el derivado de oxopirazina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 o una de sus sales, como ingrediente activo.
13. Un procedimiento de uso de un herbicida, comprendiendo el procedimiento tratar suelos y/o plantas con una cantidad eficaz del herbicida de acuerdo con la reivindicación 12.