

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 389 965**

51 Int. Cl.:
C07D 401/04 (2006.01)
A01N 47/12 (2006.01)
A01N 47/34 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08740165 .9**
96 Fecha de presentación: **10.04.2008**
97 Número de publicación de la solicitud: **2143721**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **13.01.2010**

54 Título: **Compuesto de Hidrazida y agente para el control de artrópodos nocivos que lo contiene**

30 Prioridad:
12.04.2007 JP 2007104646

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
05.11.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
05.11.2012

73 Titular/es:
SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)
27-1, SHINKAWA 2-CHOME, CHUO-KU
TOKYO 104-8260, JP

72 Inventor/es:
JACHMANN, MARKUS;
IKEGAMI, HIROSHI y
NOKURA, YOSHIHIKO

74 Agente/Representante:
UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 389 965 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto de Hidrazida y Agente para el Control de Artrópodos Nocivos que lo Contiene

5 **Campo Técnico**

La presente invención se refiere a un compuesto de hidrazida y un agente para el control de artrópodos nocivos que lo contiene.

10 **Técnica Anterior**

Los documentos WO 01/70671, WO 03/015518, WO 03/016284, WO 03/016300 y WO 03/024222 describen algunos compuestos amídicos para el control de artrópodos nocivos.

15 **Descripción de la Invención****Problema a ser resuelto por la invención**

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto novedoso que tiene una actividad excelente para el control de artrópodos nocivos.

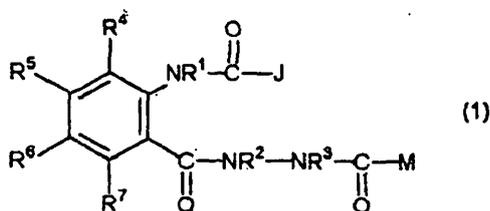
Medios para resolver el problema

Como resultado del estudio exhaustivo de los autores de la presente invención, estos han encontrado un compuesto de hidrazida representado por la siguiente fórmula (1) que tiene una actividad excelente para el control de artrópodos nocivos, y de este modo se ha completado la presente invención.

Esto es, la presente invención proporciona:

[1] Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1)

[Fórmula Química 1]:



donde

35 R^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C_2-C_6 , un grupo alcoxilalquilo C_2-C_6 , un grupo alqueno C_3-C_6 halogenado opcionalmente, un grupo alquino C_3-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo fenilalquilo C_7-C_9 cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo;

40 cada uno de R^2 y R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, o R^G (en el que al menos uno de R^2 y R^3 es R^G ,

45 R^G representa un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D mostrado más abajo, un grupo alqueno C_3-C_6 halogenado opcionalmente, un grupo alquino C_3-C_6 halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo, un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo, un grupo alquil(C_1-C_6)tio halogenado opcionalmente, un grupo alquil(C_1-C_6)sulfino halogenado opcionalmente, o un grupo alquil(C_1-C_6)sulfonilo halogenado

opcionalmente,

50 "Grupo D:

(a) un grupo ciano,
 (b) un grupo nitro,
 (c) $-C(=O)OR^{101}$ (R^{101} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_4),
 (d) $-C(=O)NR^{102}R^{103}$ (cada uno de R^{102} y R^{103} representa independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_4),
 55 (e) $-C(=O)R^{104}$ (R^{104} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo),

(f) $-\text{CR}^{105}=\text{N}-\text{OR}^{106}$ (R^{105} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo, y R^{106} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$),

(g) $-\text{OR}^{107}$ (R^{107} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo),

(h) $-\text{S}(\text{O})_j\text{R}^{108}$ (R^{108} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo, y j representa un número entero de 0 a 2),

(i) $-\text{NR}^{109}\text{R}^{110}$ (cada uno de R^{109} y R^{110} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_9$, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo),

(j) un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo,

(k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo,

(l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo,

(m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo, y

(n) un grupo estirilo cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo");

R^4 representa un átomo de halógeno, o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente;

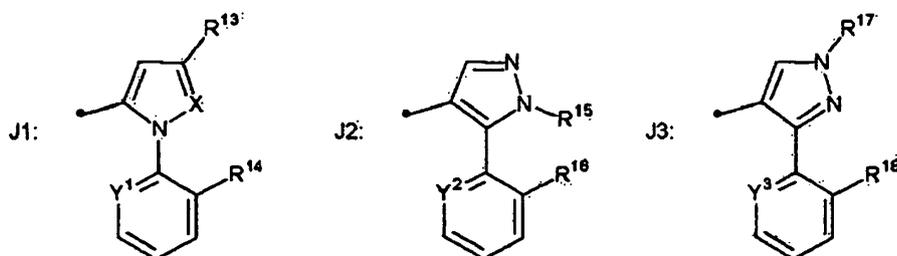
cada uno de R^5 , R^6 y R^7 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, o

R^5 y R^6 se pueden combinar para formar un grupo a 1,3-butadieno-1,4-diilo sustituido opcionalmente con un sustituyente C mostrado más abajo;

M representa $-\text{R}^8$, $-\text{OR}^9$, $-\text{SR}^{10}$, o $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ (donde R^8 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, un grupo alcoxilquilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, un grupo alqueniilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, o un grupo alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, cada uno de R^9 , R^{10} , R^{11} y R^{12} representa independientemente un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, un grupo alcoxilquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, un grupo alqueniilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, o un grupo alquinilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente);

J representa uno cualquiera de J1 a J3 mostrados más abajo:

[Fórmula Química 2]



{donde X representa un átomo de nitrógeno o CR^{19} ; Y^1 representa un átomo de nitrógeno o CR^{20} ;

Y^2 representa un átomo de nitrógeno o CR^{21} ;

Y^3 representa un átomo de nitrógeno o CR^{22} ;

cada uno de R^{13} y R^{19} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, un grupo alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, un grupo alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)tio halogenado opcionalmente, un grupo alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)sulfonilo halogenado opcionalmente, o un grupo alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)sulfonilo halogenado opcionalmente;

R^{15} y R^{17} representan cada uno independientemente un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente;

cada uno de R^{14} , R^{16} , R^{18} , R^{20} , R^{21} y R^{22} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente};

sustituyente A: un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, y un grupo alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente;

sustituyente B: un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$; y

sustituyente C: un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente (más adelante, a veces, referido como el presente compuesto);

[2] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [1], donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D1 mostrado más abajo,

un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B;

"grupo D1: (a) un grupo ciano, (g) -OR¹⁰⁷ (R¹⁰⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A), (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A, (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A; y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B";

[3] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [2], donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D2 mostrado más abajo, un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente;

"grupo D2: (a) un grupo ciano y (g) -OR¹⁰⁷ (R¹⁰⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A)";

[4] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [2], donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D3 mostrado más abajo, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B; "grupo D3: (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A, (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B";

[5] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [3], donde, en la fórmula (1), uno de R² y R³ es R^G, y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, y R³ es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano, un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente;

[6] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [1], donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D;

[7] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [6], donde en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano;

[8] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [7], donde, en la fórmula (1), R² es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano; y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente;

[9] El compuesto de hidrazida de acuerdo con el anterior apartado [7], donde, en la fórmula (1), R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; y R³ es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano;

[10] Un agente para el control de artrópodos nocivos que comprende el compuesto de hidrazida de acuerdo con uno cualquiera de los anteriores apartados [1] a [9] como agente activo;

[11] El uso del compuesto de hidrazida de acuerdo con uno cualquiera de los anteriores apartados [1] a [9] como agente activo de un agente para el control de artrópodos nocivos;

[12] Un método para el control de artrópodos nocivos, que comprende aplicar el compuesto de hidrazida de acuerdo con uno cualquiera de los anteriores apartados [1] a [9] directamente a los artrópodos nocivos, o aplicar a los hábitats de los artrópodos nocivos, donde el término "hábitats" significa plantas, suelos y casas;

[13] El uso del compuesto de hidrazida de acuerdo con uno cualquiera de los anteriores apartados [1] a [9] para la producción de un agente para el control de artrópodos nocivos.

Efecto de la invención

El presente compuesto tiene una actividad excelente para el control de artrópodos nocivos y por lo tanto es útil como agente activo de un agente para el control de artrópodos nocivos.

Mejor Modo de Llevar a Cabo la Invención

En la presente invención, los ejemplos del "átomo de halógeno" incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los ejemplos del "grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano" incluyen un grupo cianometilo, un grupo 1-cianoetilo, un grupo 2-cianoetilo, un grupo 2-cianopropilo, un grupo 1-ciano-2-propilo, un grupo 1-ciano-2-metil-2-propilo, un grupo 3-ciano-2-butilo, un grupo 3-cianopropilo, un grupo 4-cianobutilo y un grupo 6-cianohexilo.

Los ejemplos del "grupo alquilo C₁-C₄" incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo, un grupo isopropilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo y un grupo terc-butilo.

Los ejemplos del " grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente" incluyen un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo clorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo etilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo propilo, un

grupo isopropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo terc-butilo, un grupo pentilo y un grupo hexilo.

5 Los ejemplos del "grupo alqueno C_2-C_6 halogenado opcionalmente" incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-metilvinilo, un grupo 2-clorovinilo y un grupo 2-metil-1-propenilo.

10 Los ejemplos del "grupo alqueno C_3-C_6 halogenado opcionalmente" incluyen un grupo 2-propenilo, un grupo 3-cloro-2-propenilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 2-bromo-2-propenilo, un grupo 3,3-dibromo-2-propenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 3-metil-2-butenilo, un grupo 2-pentenilo y un grupo 2-hexenilo.

15 Los ejemplos del "grupo alqueno C_2-C_6 halogenado opcionalmente" incluyen un grupo etinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 3-cloro-2-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 2-butenilo y un grupo 3-butenilo.

Los ejemplos del "grupo alqueno C_3-C_6 halogenado opcionalmente" incluyen un grupo 2-propinilo, un grupo 3-cloro-2-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-butenilo y un grupo 3-butenilo.

20 Los ejemplos del "grupo cianoalquilo C_2-C_6 " incluyen un grupo cianometilo, un grupo 1-cianoetilo, un grupo 2-cianoetilo, un grupo 2-cianopropilo, un grupo 1-ciano-2-propilo, un grupo 1-ciano-2-metil-2-propilo, un grupo 3-ciano-2-butilo, un grupo 3-cianopropilo y un grupo 4-cianobutilo.

25 Los ejemplos del "grupo alcoialquilo C_2-C_6 " incluyen un grupo metoximetilo, un grupo 1-metoxietilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo y un grupo 2-isopropiloxietilo.

Los ejemplos del "grupo alcoialquilo C_3-C_6 " incluyen un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo y un grupo 2-isopropiloxietilo.

30 Los ejemplos del "grupo alcoxi(C_2-C_6)carbonilo" incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo isopropoxicarbonilo y un grupo terc-butoxicarbonilo.

35 Los ejemplos del "grupo 1,3-butadieno-1,4-diilo sustituido opcionalmente con un sustituyente C" incluyen un grupo 1,3-butadieno-1,4-diilo, un grupo 2-bromo-1,3-butadieno-1,4-diilo, un grupo 2-cloro-1,3-butadieno-1,4-diilo, un grupo 2-ciano-1,3-butadieno-1,4-diilo y un grupo 1-metil-1,3-butadieno-1,4-diilo.

Los ejemplos del "grupo alcoxi C_1-C_6 halogenado opcionalmente" incluyen un grupo metoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo etoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo propiloxi, un grupo isopropiloxi, un grupo butoxi, un grupo isobutiloxi, un grupo sec-butoxi, un grupo terc-butoxi, un grupo pentiloxi y un grupo hexiloxi.

40 Los ejemplos del "grupo alquil(C_1-C_6)tio halogenado opcionalmente" incluyen un grupo metiltio, un grupo trifluorometiltio y un grupo etiltio .

Los ejemplos del "grupo alquil(C_1-C_6)sulfinito halogenado opcionalmente" incluyen un grupo metilsulfinito, un grupo trifluorometilsulfinito y un grupo etilsulfinito .

45 Los ejemplos del "grupo alquil(C_1-C_6)sulfonilo halogenado opcionalmente" incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo trifluorometilsulfonilo y un grupo etilsulfonilo .

50 Los ejemplos del "grupo trialquil(C_3-C_6)sililo" incluyen un grupo trimetilsililo y un grupo terc-butildimetilsililo .

55 Los ejemplos del "grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A" incluyen un grupo fenilo, un grupo 2-clorofenilo, un grupo 3-clorofenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 4-bromofenilo, un grupo 4-yodofenilo, un grupo 2-cianofenilo, un grupo 3-cianofenilo, un grupo 4-cianofenilo, un grupo 2-nitrofenilo, un grupo 3-nitrofenilo, un grupo 4-nitrofenilo, un grupo 2-metilfenilo, un grupo 3-metilfenilo, un grupo 4-metilfenilo, un grupo 2-(trifluorometil)fenilo, un grupo 3-(trifluorometil)fenilo, un grupo 4-(trifluorometil)fenilo, un grupo 2-metoxifenilo, un grupo 3-metoxifenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo y un grupo 4-(metiltio)fenilo .

60 Los ejemplos del grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros en el "grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A" incluyen un grupo 1-pirrolilo, un grupo 2-pirrolilo, un grupo 3-pirrolilo, un grupo 2-furilo, un grupo 3-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 3-tienilo, un grupo 1-pirazolilo, un grupo 3(5)-pirazolilo, un grupo 4-pirazolilo, un grupo 1-imidazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 4-imidazolilo, un grupo 2-piridinilo, un grupo 3-piridinilo, un grupo 4-piridinilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 4-pirimidinilo, un grupo 5-pirimidinilo y un grupo pirazinilo .

Los ejemplos del "grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B" incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo 4-metilciclohexilo, un grupo 4-etilciclohexilo, un grupo 4-isopropilciclohexilo y un grupo 4-terc-butilciclohexilo .

5 Los ejemplos del "grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B" incluyen un grupo oxetan-3-ilo, un grupo tetrahydrofuran-2-ilo, un grupo tetrahydrofuran-3-ilo, un grupo tetrahydrofuran-4-ilo, un grupo 1,3-dioxolan-2-ilo, un grupo 1,3-dioxolan-4-ilo y un grupo 2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-ilo .

10 Los ejemplos del "grupo fenilalquilo C₇-C₉ cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A" incluyen un grupo bencilo, un grupo 1-feniletilo, un grupo 2-feniletilo, un grupo 2-clorobencilo, un grupo 3-clorobencilo, un grupo 4-clorobencilo, un grupo 4-bromobencilo, un grupo 2-cianobencilo, un grupo 3-cianobencilo, un grupo 4-cianobencilo, un grupo 2-nitrobencilo, un grupo 3-nitrobencilo, un grupo 4-nitrobencilo, un grupo 2-metilbencilo, un grupo 3-metilbencilo, un grupo 4-metilbencilo, un grupo 2-metoxibencilo, un grupo 3-metoxibencilo y un grupo 4-metoxibencilo .

15 El grupo estirilo es un grupo representado por -CH=CH-Ph (Ph representa un grupo fenilo) y los ejemplos del "grupo estirilo cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A" incluyen un grupo estirilo, un grupo 2-cloroestirilo, un grupo 3-cloroestirilo, un grupo 4-cloroestirilo, un grupo 4-bromoestirilo, un grupo 2-cianoestirilo, un grupo 3-cianoestirilo, un grupo 4-cianoestirilo, un grupo 2-nitroestirilo, un grupo 3-nitroestirilo, un grupo 4-nitroestirilo, un grupo 2-metilestirilo, un grupo 3-metilestirilo, un grupo 4-metilestirilo, un grupo 2-metoxiestirilo, un grupo 3-metoxiestirilo y un grupo 4-metoxiestirilo .

20 Los ejemplos del "grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un grupo seleccionado del grupo D" incluyen un grupo cianometilo, un grupo 1-cianoetilo, un grupo 2-cianoetilo, un grupo 2-cianopropilo, un grupo 1-ciano-2-propilo, un grupo 1-ciano-2-metil-2-propilo, un grupo 3-ciano-2-butilo, un grupo 3-cianopropilo, un grupo 4-cianobutilo, un grupo 2-nitroetilo, un grupo metoxicarbonilmetilo, un grupo etoxicarbonilmetilo, un grupo isopropoxicarbonilmetilo, un grupo terc-butoxicarbonilmetilo, un grupo N,N-dimetilcarbamoilmetilo, un grupo 2-oxopropilo, un grupo 2-oxo-3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 2-oxo-2-feniletilo, un grupo 2-(metoxiimino)etilo, un grupo metoximetilo, un grupo 1-metoxietilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 2-isopropiloxietilo, un grupo 2-fenoxietilo, un grupo 2-(metiltio)etilo, un grupo 2-(metilsulfinil)etilo, un grupo 2-(metilsulfonil)etilo, un grupo 2-(N,N-dimetilamino)etilo, un grupo ciclopropilmetilo, un grupo 1-(ciclopropil)etilo, un grupo 1-(1-metilciclopropil)etilo, un grupo ciclobutilmetilo, un grupo ciclopentilmetilo, un grupo ciclohexilmetilo, un grupo bencilo, un grupo 2-piridilmetilo, un grupo 3-piridilmetilo, un grupo 4-piridilmetilo, un grupo 2-furilmetilo, un grupo oxetan-3-ilmetilo, un grupo tetrahydrofuran-2-ilmetilo, un grupo tetrahydrofuran-3-ilmetilo, un grupo tetrahydrofuran-4-ilmetilo, un grupo 1,3-dioxolan-2-ilmetilo, un grupo 1,3-dioxolan-4-ilmetilo, un grupo 2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-ilmetilo y un grupo 3-fenil-2-propenilo .

Los ejemplos del presente compuesto incluyen los siguientes aspectos.

40 **"Aspecto 1"**

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D.

45 **"Aspecto 2"**

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano.

50 **"Aspecto 3"**

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R² es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano; y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente.

55 **"Aspecto 4"**

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; y R³ es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano.

60 **"Aspecto 5"**

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R¹ es un átomo de hidrógeno.

"Aspecto 6"

5 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R¹ es un átomo de hidrógeno; y uno cualquiera de R² y R³ es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano, y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 7"

10 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde J es J1,

"Aspecto 8"

15 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es -R⁸ o a -OR⁹.

"Aspecto 9"

20 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R¹ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R² es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano; R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R⁴ es un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R⁵, R⁶ y R⁷ representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; M es -R⁸, -OR⁹ o -NR¹¹R¹²; R⁸ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; cada uno de R¹¹ y R¹² representa independientemente un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; J es J1; X es un átomo de nitrógeno o CH; Y¹ es un átomo de nitrógeno o CH; R¹³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alcoxi C₁-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquil(C₁-C₆)tio halogenado opcionalmente; y R¹⁴ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 10"

30 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R¹ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R³ es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano; R⁴ es un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; cada uno de R⁵, R⁶ y R⁷ representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; M es -R⁸, -OR⁹ o -NR¹¹R¹²; R⁸ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; R⁹ es un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; cada uno de R¹¹ y R¹² representa independientemente un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente; J es J1; X es un átomo de nitrógeno o CH; Y¹ es un átomo de nitrógeno o CH; R¹³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alcoxi C₁-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquil(C₁-C₆)tio halogenado opcionalmente; y R¹⁴ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 11"

45 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R¹ es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; R² es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano; R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo halogenado opcionalmente; R⁴ es un átomo de halógeno o un grupo metilo; R⁵ y R⁷ son átomos de hidrógeno; R⁶ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo metilo; M es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi o un grupo dimetilamino; J es J1; X es un átomo de nitrógeno o CH; Y¹ es un átomo de nitrógeno; R¹³ es un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo trifluorometilo; y R¹⁴ es un átomo de halógeno.

"Aspecto 12"

55 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R¹ es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo halogenado opcionalmente; R³ es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano; R⁴ es un átomo de halógeno o un grupo metilo; R⁵ y R⁷ son átomos de hidrógenos; R⁶ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo metilo; M es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi o un grupo dimetilamino; J es J1; X es un átomo de nitrógeno o CH; Y¹ es un átomo de nitrógeno; R¹³ es un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo trifluorometilo; y R¹⁴ es un átomo de halógeno.

"Aspecto 13"

65 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D1 mostrado más abajo, un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado

opcionalmente, un grupo alquínilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B:

5 "grupo D1: (a) un grupo ciano, (g) -OR¹⁰⁷ (R¹⁰⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A), (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A, (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B".

"Aspecto 14"

15 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D2 mostrado más abajo, un grupo alquénilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquínilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente; "grupo D2: (a) un grupo ciano y (g) -OR¹⁰⁷ (R¹⁰⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A)".

20 "Aspecto 15"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo ciano, un grupo alquénilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquínilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente.

25 "Aspecto 16"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquénilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente o un grupo alquínilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente.

30 "Aspecto 17"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquénilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente.

35 "Aspecto 18"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquínilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente.

40 "Aspecto 19"

45 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D3 mostrado más abajo, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B;

50 "grupo D3: (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A, (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B".

55 "Aspecto 20"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B.

60 "Aspecto 21"

65 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D3 mostrado más abajo: "grupo D3: (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A,

(l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B".

"Aspecto 22"

5 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D4 mostrado más abajo, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 sustituido opcionalmente con un sustituyente B, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B;

10 "grupo D4: (j) un grupo cicloalquilo C_3-C_6 sustituido opcionalmente con un sustituyente B y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B".

"Aspecto 23"

15 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^G es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D5 mostrado más abajo, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B:

20 "grupo D5: (1) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B".

"Aspecto 24"

25 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde uno de R^2 y R^3 es R^G , y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente.

"Aspecto 25"

30 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^2 es R^G y R^3 es un átomo de hidrógeno.

"Aspecto 26"

35 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es R^G .

"Aspecto 27"

40 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^2 es R^G y R^3 es un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente.

"Aspecto 28"

45 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^2 es un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente y R^3 es R^G .

"Aspecto 29"

50 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde uno de R^2 y R^3 es R^G , y el otro es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo.

"Aspecto 30"

55 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^2 es R^G y R^3 es un grupo metilo o un grupo etilo.

"Aspecto 31"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^2 es un grupo metilo o un grupo etilo y R^3 es R^G .

"Aspecto 32"

60 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde uno de R^2 y R^3 es R^G , y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente; y R^G es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo ciano, un grupo alqueno C_3-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo alquino C_3-C_6 halogenado opcionalmente.

"Aspecto 33"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es $-\text{OR}^9$.

"Aspecto 34"

5 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es $-\text{OR}^9$ y R^9 es un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 35"

10 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es $-\text{R}^8$, $-\text{OR}^9$ o $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, R^8 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, R^9 es un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, y cada uno de R^{11} y R^{12} representa independientemente un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 36"

15 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo dimetilamino.

"Aspecto 37"

20 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es un grupo metoxi o un grupo etoxi.

"Aspecto 38"

25 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde M es un átomo de hidrógeno o un grupo metoxi.

"Aspecto 39"

30 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^4 es un átomo de halógeno o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, y cada uno de R^5 , R^6 y R^7 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 40"

35 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^4 es un átomo de halógeno o un grupo metilo, R^5 y R^7 son átomos de hidrógeno, y R^6 es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano.

"Aspecto 41"

40 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde J es J_1 , X es un átomo de nitrógeno o CH, Y^1 es un átomo de nitrógeno o CH, y R^{13} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, o un grupo alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 42"

45 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde J es J_1 , X es un átomo de nitrógeno, Y^1 es un átomo de nitrógeno, R^{13} es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo trifluorometilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, y R^{14} es un átomo de halógeno.

"Aspecto 43"

50 Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^1 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente; uno de R^2 y R^3 es R^G , y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente; R^G es un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ sustituido con un grupo ciano, un grupo alqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, o un grupo alquino $\text{C}_3\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente; R^4 es un átomo de halógeno o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente; cada uno de R^5 , R^6 y R^7 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente; J es J_1 ; X es un átomo de nitrógeno o CH; Y^1 es un átomo de nitrógeno o CH; y R^{13} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente, o un grupo alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ halogenado opcionalmente.

"Aspecto 44"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^1 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente; uno de R^2 y R^3 es R^6 , y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente; R^6 es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo ciano, un grupo alqueno C_3-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo alquino C_3-C_6 halogenado opcionalmente; R^4 es un átomo de halógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente; cada uno de R^5 , R^6 y R^7 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente; M es -OR⁹; J es J1; X es un átomo de nitrógeno o CH; Y¹ es un átomo de nitrógeno o CH; y R¹³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo alcoxi C_1-C_6 halogenado opcionalmente.

"Aspecto 45"

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^1 es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; uno de R^2 y R^3 es un grupo cianometilo, un grupo 2-propenilo o un grupo 2-propinilo, y el otro es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo; R^4 es un átomo de halógeno o un grupo metilo; R^5 y R^7 son átomos de hidrógeno; R^6 es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano; M es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo dimetilamino; J es J1; X es un átomo de nitrógeno; Y¹ es un átomo de nitrógeno; R¹³ es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo trifluorometilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi; y R¹⁴ es un átomo de halógeno.

"Aspecto 46"

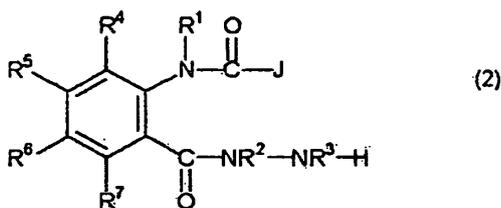
Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1), donde R^1 es un átomo de hidrógeno; uno de R^2 y R^3 es un grupo cianometilo, un grupo 2-propenilo o un grupo 2-propinilo, y el otro es un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo; R^4 es un átomo de halógeno o un grupo metilo; R^5 y R^7 son átomos de hidrógeno; R^6 es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano; M es un grupo metoxi o un grupo etoxi; J es J1; X es un átomo de nitrógeno; Y¹ es un átomo de nitrógeno; R¹³ es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo trifluorometilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi; y R¹⁴ es un átomo de halógeno.

Más adelante, se explicará un procedimiento para producir el presente compuesto.

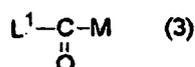
El presente compuesto se puede producir, por ejemplo, mediante el siguiente Procedimiento A-1 a Procedimiento C-3.

(Procedimiento A)

El presente compuesto se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (2):

[Fórmula Química 3]

donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (2)) con un compuesto representado por la fórmula (3):

[Fórmula Química 4]

donde M se define como antes y L^1 representa un átomo de halógeno o un grupo M-C(=O)- (más adelante referido como el compuesto (3)).

La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, dietil éter, tetrahydrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos

tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (3) utilizado en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por mol del compuesto (2).

La reacción se lleva a cabo en presencia de una base, si fuera necesario. Los ejemplos de la base cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de una base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), y 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN); aminas terciarias tales como trietilamina, y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, e hidruro de sodio. La cantidad de la base cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de la base es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (2).

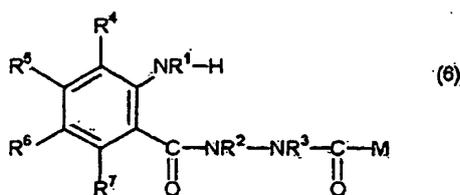
La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el presente compuesto se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El presente compuesto aislado se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

(Procedimiento B-1)

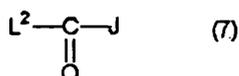
El presente compuesto se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (6):

[Fórmula Química 5]



donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y M se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (6)) con un compuesto representado por la fórmula (7):

[Fórmula Química 6]



donde L² representa un átomo de halógeno y J se define como antes (más adelante referido como el compuesto (7)).

La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahydrofurano, y metil terc-butyl éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (7) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (6).

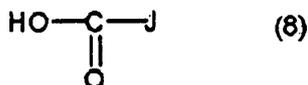
La reacción se lleva a cabo en presencia de una base, si fuera necesario. Los ejemplos de la base cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de una base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), y 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN); aminas terciarias tales como trietilamina, y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, e hidruro de sodio. La cantidad de la base cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de la base es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (6).

La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el presente compuesto se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El presente compuesto aislado se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

(Procedimiento B-2)

5 El presente compuesto se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (6) con un compuesto representado por la fórmula (8) :

[Fórmula Química 8]

10 donde J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (8)) en presencia de un agente deshidratante.

15 La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

20 La cantidad del compuesto (8) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (6).

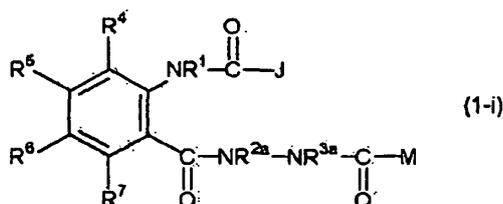
25 Los ejemplos del agente deshidratante utilizado en la reacción incluyen carbodiimidas tales como dicitohexilcarbodiimida (DCC), e hidrocloreuro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (WSC). La cantidad de el agente deshidratante que se va a utilizar es usualmente de 1 o más por mol del compuesto (6).

La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

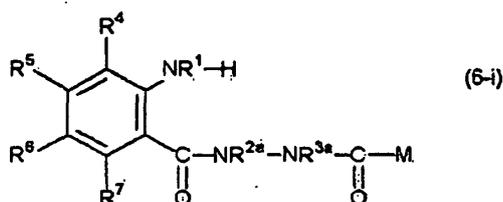
30 Una vez completada la reacción, el presente compuesto se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El presente compuesto aislado se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, cromatografía, o similares.

(Procedimiento B-3)

35 Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-i):

[Fórmula Química 8]

40 donde R^{2a} representa R^G, R^{3a} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente o R^G, o R^{2a} representa un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, R^{3a} representa R^G, y R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, J y M se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (1-i)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (6-i) representado por la fórmula (6-i):

[Fórmula Química 9]

45 donde R¹, R^{2a}, R^{3a}, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y M se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (6-i)) con un compuesto representado por la fórmula (4):

50

[Fórmula Química 10]



5 donde J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (4)) en presencia de un agente oxidante, por ejemplo, perácidos tales como ácido metacloroperbenzoico; y compuestos de quinona tales como o-cloranilo, y p-cloranilo.

10 La reacción se lleva a cabo en presencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres disolventes tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados disolventes tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; disolventes hidrocarbonados tales como hexano, heptano, tolueno, benceno, y xileno; nitrilos disolventes tales como acetonitrilo; amidas disolventes tales como N,N-dimetilformamida; compuestos cíclicos disolventes que contienen nitrógeno tales como N-metilpirrolidona, y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; disolventes apróticos, por ejemplo, sulfóxidos disolventes tales como dimetilsulfoxido; ácidos carboxílicos disolventes tales como ácido acético; cetonas disolventes tales como acetona, y isobutil metil cetona; ésteres disolventes tales como acetato de etilo; alcoholes disolventes tales como 2-propanol, y alcohol terc-butílico; agua; y una mezcla de los mismos.

20 La cantidad del compuesto (4) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (6-i).

La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 150°C y el tiempo de reacción es usualmente de un instante a 72 horas.

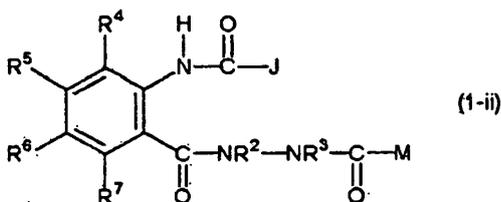
25 Una vez completada la reacción, el compuesto (1-i) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto (1-i) aislado se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

[Procedimiento C-1]

30

Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-ii):

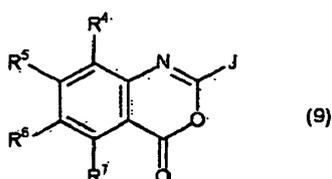
[Fórmula Química 11]



35

donde R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, J y M se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (1-ii)) se produce haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (9):

[Fórmula Química 12]

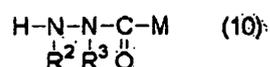


40

donde R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (9)) con un compuesto representado por la fórmula (10):

45

[Fórmula Química 13]



donde R^2 , R^3 y M se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (10)).

La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (10) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (9).

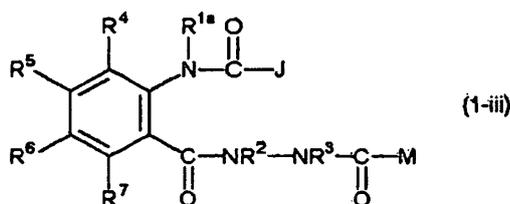
La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 48 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (1-ii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto (1-ii) aislado se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

(Procedimiento C-2)

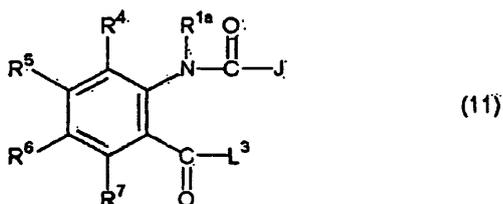
Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-iii):

[Fórmula Química 14]



donde R^{1a} representa un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C_2-C_6 , un grupo alcoxilquilo C_2-C_6 , un grupo alqueniilo C_3-C_6 halogenado opcionalmente, un grupo alquinilo C_3-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo fenilalquilo C_7-C_9 cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , J y M se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (1-iii)) se produce haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (11):

[Fórmula Química 15]



donde L^3 representa un átomo de halógeno, y R^{1a} , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (11)) con el compuesto (10).

La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (10) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (11).

La reacción se lleva a cabo en presencia de una base, si fuera necesario. Los ejemplos de la base cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de una base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), y 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN); aminas terciarias tales como trietilamina, y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como

carbonato de potasio, e hidruro de sodio. La cantidad de la base cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de la base es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (6).

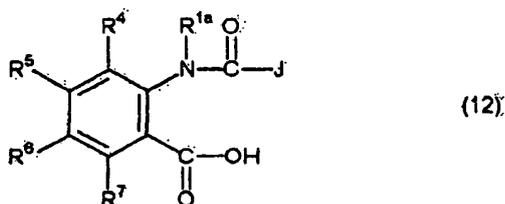
La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (1-iii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (1-iii) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

(Procedimiento C-3)

El compuesto (1-iii) se puede producir también haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (12):

[Fórmula Química 16]



donde R^{1a}, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (12)) con el compuesto (10) en presencia de un agente deshidratante.

La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (10) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (12).

Los ejemplos del agente deshidratante utilizado en la reacción incluyen carbodiimidas tales como dicitclohexilcarbodiimida (DCC), e hidrocloreuro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (WSC). La cantidad de el agente deshidratante utilizado es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (12).

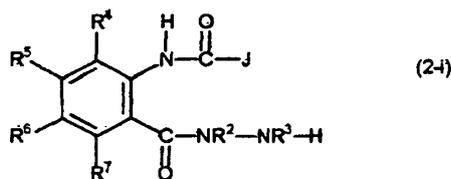
La temperatura de reacción es usualmente de 0 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (1-iii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (1-iii) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

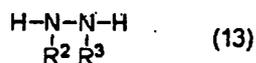
Más adelante, se explicará un método para producir intermedios para producir el presente compuesto.

Entre los compuestos (2), un compuesto representado por la fórmula (2-i):

[Fórmula Química 17]



donde R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (2-i)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (9) con un compuesto representado por la fórmula (13):

[Fórmula Química 18]

donde R^2 y R^3 se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (13)).

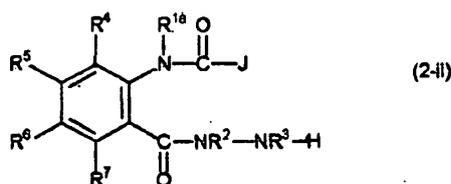
5 La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (13) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (9).

La temperatura de reacción es usualmente de -50 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (2-i) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (2-i) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

Entre los compuestos (2), un compuesto representado por la fórmula (2-ii):

[Fórmula Química 19]

25 donde R^{1a} , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y J se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (2-ii)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (11) con el compuesto (13).

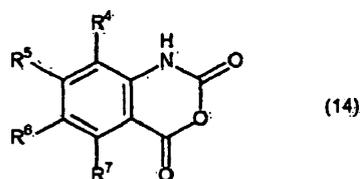
La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

35 La cantidad del compuesto (13) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (11).

La temperatura de reacción es usualmente de -50 a 100°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (2-ii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (2-ii) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

El compuesto (9) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (14):

[Fórmula Química 20]

donde R^4 , R^5 , R^6 y R^7 se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (14)) con el compuesto (7).

La reacción se lleva a cabo en presencia de una base en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (7) utilizado en la reacción es usualmente de 0,5 a 2 moles por mol del compuesto (14).

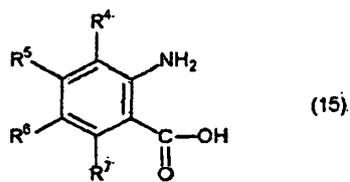
Los ejemplos de la base utilizado en la reacción incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), y 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN); aminas terciarias tales como trietilamina, y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, e hidruro de sodio. La cantidad de la base es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (14).

La temperatura de reacción es usualmente de 50 a 150°C y el tiempo de reacción es usualmente de 1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (9) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (9) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

El compuesto (9) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (15):

[Fórmula Química 21]



donde R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (15)) con el compuesto (7).

La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

El procedimiento comprende las siguientes (etapa 5-1) y (etapa 5-2).

(Etapa 5-1)

La etapa se lleva a cabo haciendo reaccionar el compuesto (15) con el compuesto (7) en presencia de una base.

La cantidad del compuesto (7) utilizado en la etapa es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (15). Los ejemplos de la base utilizado en la etapa incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), y 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN); aminas terciarias tales como trietilamina, y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, e hidruro de sodio. La cantidad de la base utilizada es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (15).

La temperatura de reacción de la etapa es usualmente de 0 a 50°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la etapa, la mezcla de reacción se utiliza tal cual para la siguiente (etapa 5-2).

(Etapa 5-2)

La etapa se lleva a cabo haciendo reaccionar la mezcla de reacción en la (etapa 5-1) con un haluro de sulfonilo en presencia de una base.

Los ejemplos del haluro de sulfonilo utilizado en la etapa incluyen cloruro de metanosulfonilo, cloruro de p-toluenosulfonilo, y trifluorocloruro de metanosulfonilo. La cantidad del haluro de sulfonilo utilizado en la etapa es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (15) utilizado en la (etapa 5-1).

5 Los ejemplos de la base utilizada en la etapa incluyen las mismas bases que se han descrito con respecto a la (etapa 5-1) y usualmente incluyen las mismas bases que se han descrito con respecto a la (etapa 5-1). La cantidad de la base utilizada es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (15) utilizado en la (etapa 5-1).

10 La temperatura de reacción de la etapa es usualmente de 0 a 50°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada esta etapa, el compuesto (9) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, seguido de extracción convencional con un disolvente orgánico. El compuesto aislado (9) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

15 El compuesto (11) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (12) con un agente halogenante.

20 La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

25 Los ejemplos del agente halogenante utilizado en la reacción incluyen cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, oxicluro de fósforo, oxibromuro de fósforo, pentacloruro de fósforo, cloruro de oxalilo y fosgeno.

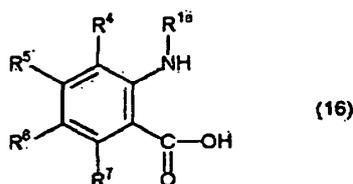
30 La cantidad del agente halogenante utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (12).

La temperatura de reacción es usualmente de 0°C a 150°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

35 Una vez completada la reacción, el compuesto (11) se puede aislar recogiendo un precipitado depositado en la mezcla de reacción mediante filtración, o extrayendo la mezcla de reacción con un disolvente orgánico. El compuesto aislado (11) se puede utilizar usualmente en la siguiente etapa tal cual. Si fuera necesario, se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

El compuesto (12) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (16):

40 [Fórmula Química 22]



45 donde R^{1a}, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (16)) con el compuesto (7).

50 La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; y una mezcla de los mismos.

55 La cantidad del compuesto (7) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (16).

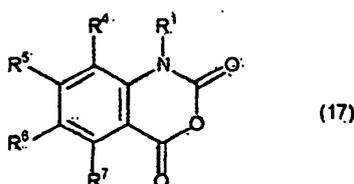
60 La reacción se lleva a cabo en presencia de una base. Los ejemplos de la base utilizada incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), y 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN); aminas terciarias tales como trietilamina, y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, e hidruro de sodio. La cantidad de la base utilizada es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (16).

La temperatura de reacción de la etapa es usualmente de 0 a 50°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

5 Una vez completada la reacción, el compuesto (12) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (12) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

10 El compuesto (6) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (17):

[Fórmula Química 23]



15 donde R¹, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ se definen como antes (más adelante referido como el compuesto (17)) con el compuesto (10).

20 La reacción se lleva a cabo en presencia o ausencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahydrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; alcoholes tales como metanol, etanol, y isopropilo alcohol; y una mezcla de los mismos.

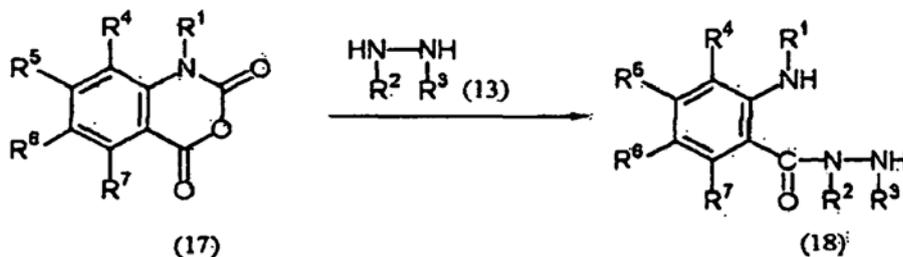
25 La cantidad del compuesto (10) utilizado en la reacción es usualmente de 1 mol o más por mol del compuesto (17).

La temperatura de reacción es usualmente de -20 a 150°C y el tiempo de reacción es usualmente de 0,1 a 24 horas.

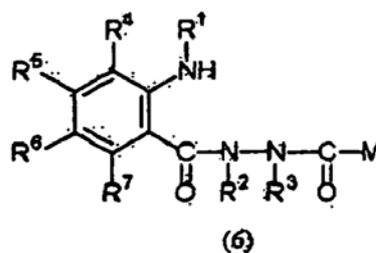
30 Una vez completada la reacción, el compuesto (6) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (6) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por medio de recristalización, o cromatografía.

35 El compuesto (6) se puede producir de acuerdo con el esquema siguiente:

[Fórmula Química 24]



- 1) Protegido
- 2) Base + L'-COM (3)
- 3) Desprotegido



40 donde L¹, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y M se definen como antes.

Compuesto (17) → Compuesto (18)

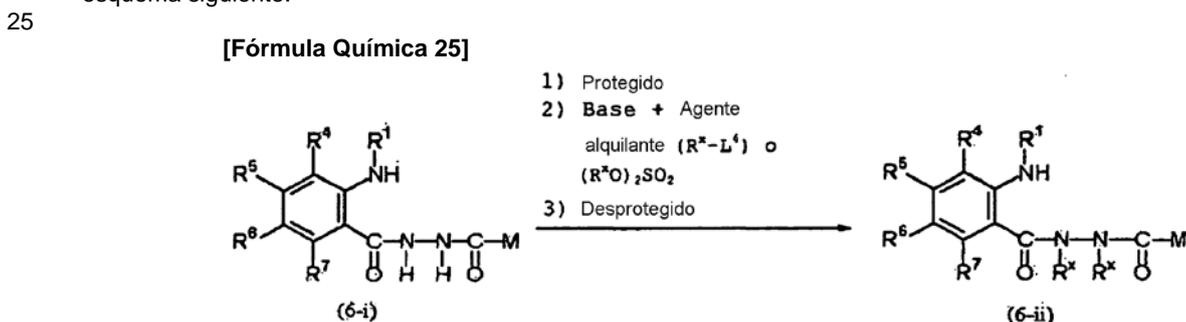
La cantidad del compuesto (13) es usualmente de 1 mol por mol del compuesto (17).

5 La reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de disolvente, y los ejemplos del disolvente incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, y metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, y clorobenceno; hidrocarburos tales como tolueno, benceno, y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y dimetilsulfoxido; alcoholes tales como metanol, etanol, y isopropilo alcohol; y una mezcla de los mismos.

Compuesto (18) → Compuesto (6)

15 1) El grupo amino (grupo -NHR¹) en el anillo de benceno del compuesto (18) se puede proteger con un grupo protector adecuado (p. ej. un grupo N-bencilideno, un grupo N-(1-metil)etilideno, y un grupo benciloxicarbonilo) descrito en Protective Groups in Organic Synthesis de Greene (WILEY) etc., si fuera necesario.
 2) La cantidad del compuesto (3) utilizado es usualmente de 1 moles por mol del compuesto (18) o un derivado del mismo donde el grupo amino está protegido. Los ejemplos de la base utilizada en la reacción incluyen carbonatos metálicos tales como carbonato de potasio.
 20 3) El compuesto (6) donde el grupo amino está protegido se puede desproteger en condiciones conocidas.

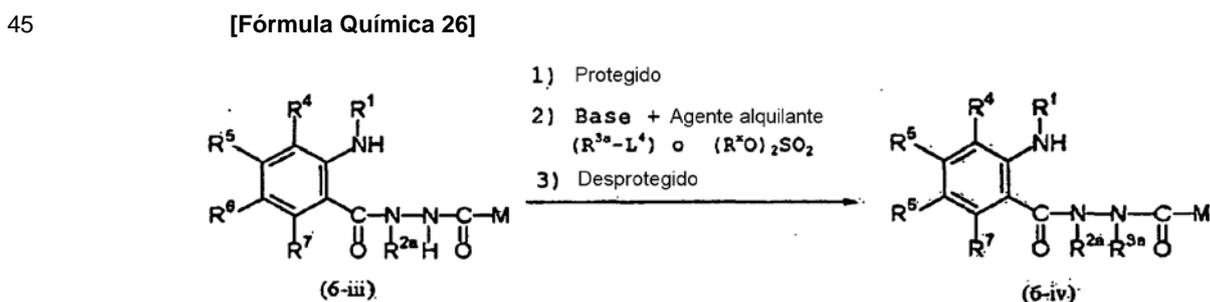
Entre los compuestos (6), un compuesto representado por la fórmula (6-ii) se puede producir de acuerdo con el esquema siguiente:



30 donde R^x representa un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente o R^G, L⁴ representa un grupo eliminable (p. ej., un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, y un grupo p-toluenosulfonilo) y R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R^G y M se definen como antes.

35 1) Protección
 El grupo amino (grupo -NHR¹) en el anillo de benceno del compuesto (6-i) se puede proteger con un grupo protector adecuado (p. ej., un grupo N-bencilideno, un grupo N-(1-metil)etilideno, y un grupo benciloxicarbonilo) descrito en Protective Groups in Organic Synthesis de Greene (WILEY) etc., si fuera necesario.
 2) La cantidad de agente alquilante utilizado es usualmente de 2 moles por mol del compuesto (6-i) o un derivado del mismo donde el grupo amino está protegido. Los ejemplos de la base utilizada en la reacción incluyen carbonatos metálicos tales como carbonato de potasio.
 40 3) El compuesto (6-ii) donde el grupo amino está protegido se puede desproteger en condiciones conocidas.

El compuesto (6-iv) se puede producir de acuerdo con el esquema siguiente:



donde R^{2a} y R^{3a} representan cada uno independientemente un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente o R^6 , R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^G y M se definen como antes, y L^4 se define como antes.

1) Protección

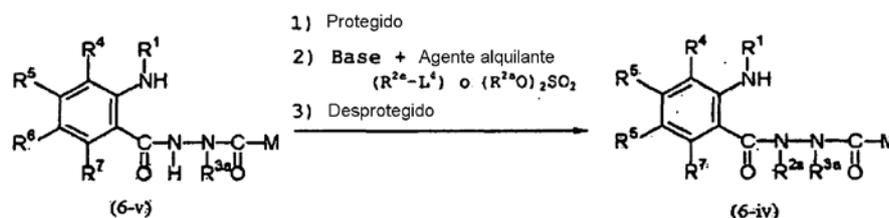
El grupo amino (grupo $-NHR^1$) en el anillo de benceno del compuesto (6-iii) se puede proteger con un grupo protector adecuado (p. ej., un grupo N-bencilideno, un grupo N-(1-metil)etilideno, y un grupo benciloxicarbonilo) descrito en Protective Groups in Organic Synthesis de Greene (WILEY) etc., si fuera necesario.

2) La cantidad del agente alquilante utilizado es usualmente de 1 moles por mol del compuesto (6-iii) o un derivado del mismo donde el grupo amino está protegido. Los ejemplos de la base utilizada en la reacción incluyen carbonatos metálicos tales como carbonato de potasio.

3) El compuesto (6-iv) donde el grupo amino está protegido se puede desproteger en condiciones conocidas.

El compuesto (6-iv) se puede producir de acuerdo con el esquema siguiente:

[Fórmula Química 27]



donde R^{2a} y R^{3a} representan cada uno independientemente un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, o R^G , R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^G y M se definen como antes, y L^4 se define como antes.

1) Protección

El grupo amino (grupo $-NHR^1$) en el anillo de benceno del compuesto (6-v) se puede proteger con un grupo protector adecuado (p. ej., un grupo N-bencilideno, un grupo N-(1-metil)etilideno, y un grupo benciloxicarbonilo) descrito en Protective Groups in Organic Synthesis de Greene (WILEY) etc., si fuera necesario.

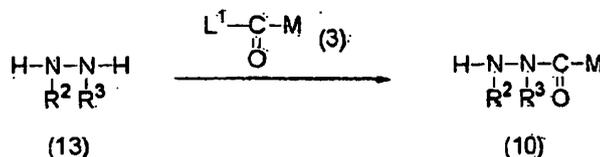
2) La cantidad del agente alquilante utilizado es usualmente de 1 moles por mol del compuesto (6-v) o un derivado del mismo donde el grupo amino está protegido. Los ejemplos de la base utilizada en la reacción incluyen carbonatos metálicos tales como carbonato de potasio.

3) El compuesto (6-iv) donde el grupo amino está protegido se puede desproteger en condiciones conocidas.

Los compuestos (3) y (13) son compuestos conocidos, o se pueden producir a partir de compuestos conocidos de acuerdo con procedimientos conocidos (véanse, por ejemplo, Organic Functional Group Preparations, 2ª edición, Vol. 1, capítulo 12, págs. 359-376, Stanley R. Sandler, Wolf Karo, u Organic Functional Group Preparations, 2ª edición, Vol. 1, capítulo 14, págs. 434-465, Stanley R. Sandler, Wolf Karo.).

El compuesto (10) se puede producir de acuerdo con un método, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

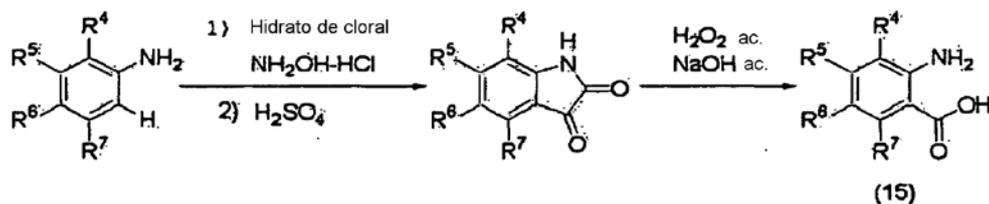
[Fórmula Química 28]



donde L^1 , R^2 , R^3 y M se definen como antes.

El compuesto (15) se puede producir de acuerdo con un método, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

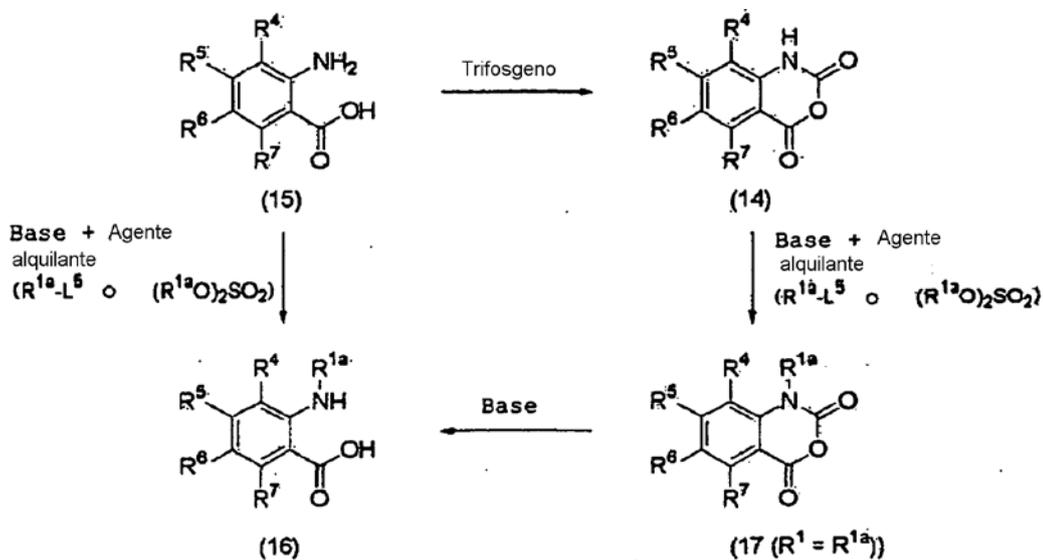
[Fórmula Química 29]



donde R^4 , R^5 , R^6 y R^7 se definen como antes.

- 5 Los compuestos (14), (16) y (17) se puede producir de acuerdo con un método, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

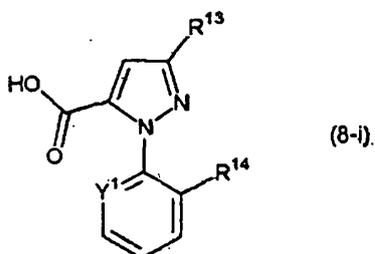
[Fórmula química 30]



- 10 donde R^{1a} , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 se definen como antes y L^5 representa un grupo eliminable (p. ej., un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, y un grupo p-toluenosulfonilo).

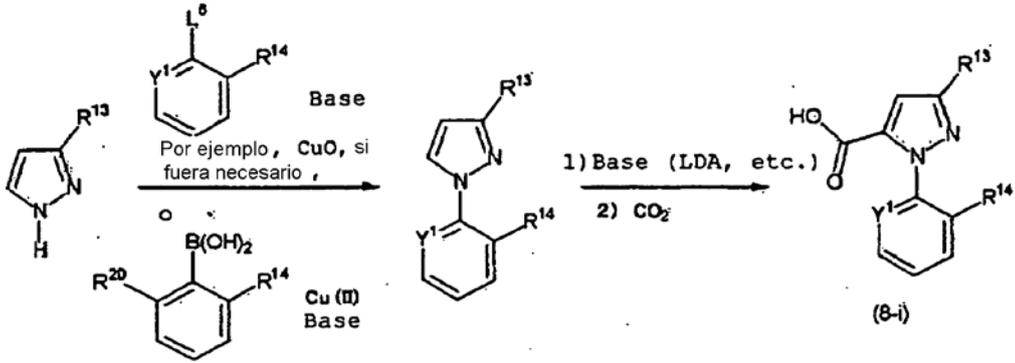
- 15 Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-i):

[Fórmula Química 31]



- 20 donde R^{13} , R^{14} y Y^1 se definen como antes, se puede producir de acuerdo con un procedimiento, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

[Fórmula Química 32]

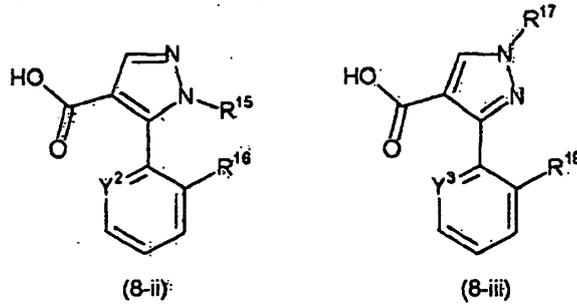


5 donde R¹⁴, R¹³, R²⁰ y Y¹ se definen como antes y L⁶ representa un grupo eliminable (p. ej., un átomo de halógeno, y un grupo metanosulfonilo).

Entre los compuestos (8), compuestos representado por la fórmula (8-ii) y la fórmula (8-iii):

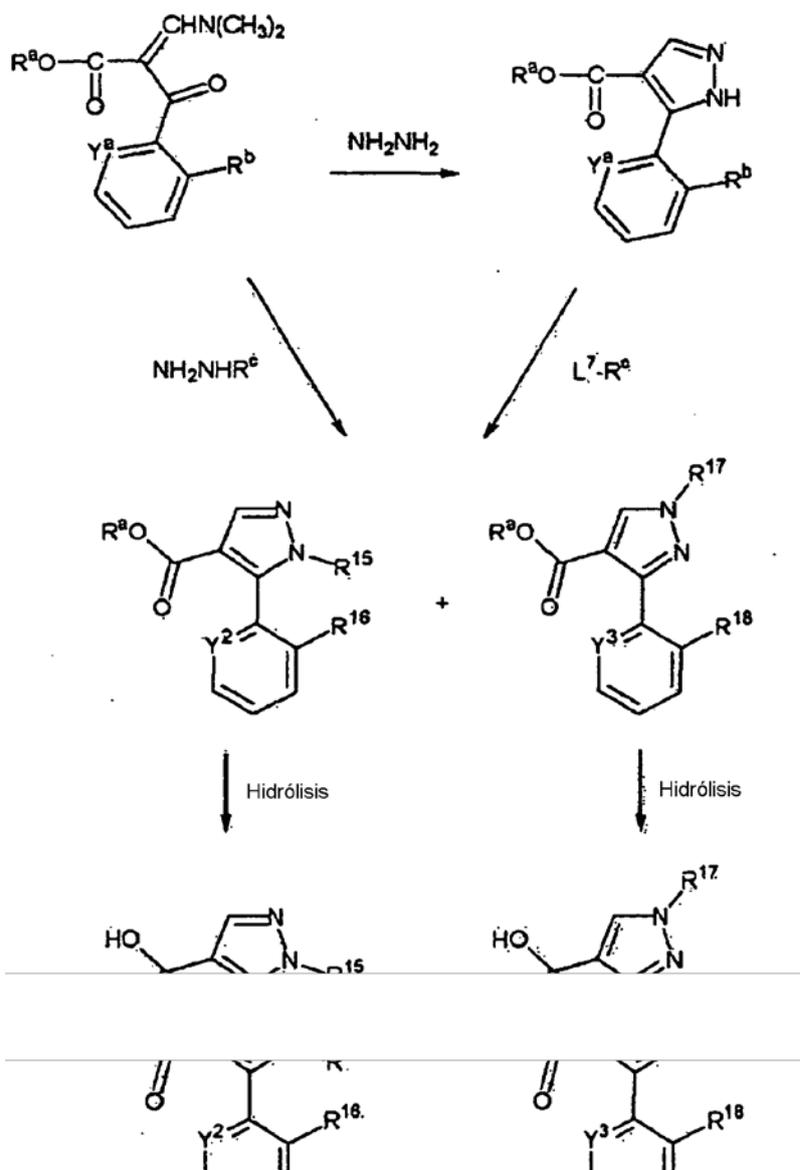
10

[Fórmula Química 33]



donde R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, Y² y Y³ se definen como antes, se puede producir de acuerdo con un procedimiento, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

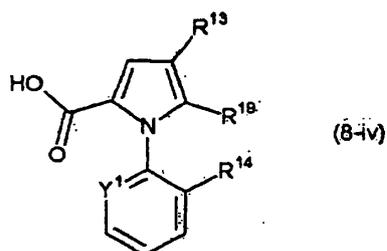
[Fórmula Química 34]



5 donde R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , Y^2 y Y^3 se definen como antes, R^a representa un grupo metilo o un grupo etilo, Y^a se define como en Y^2 o Y^3 , R^b se define como en R^{16} o R^{18} , R^c se define como en R^{15} o R^{17} , y L^7 representa un grupo eliminable (p. ej., un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, y un grupo p-toluenosulfonilo).

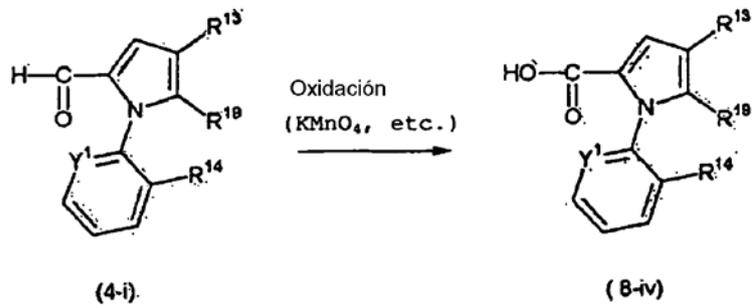
Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-iv):

[Fórmula Química 35]



10 donde R^{13} , R^{14} , R^{19} y Y^1 se definen como antes, se puede producir de acuerdo con un procedimiento, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

[Fórmula Química 36]



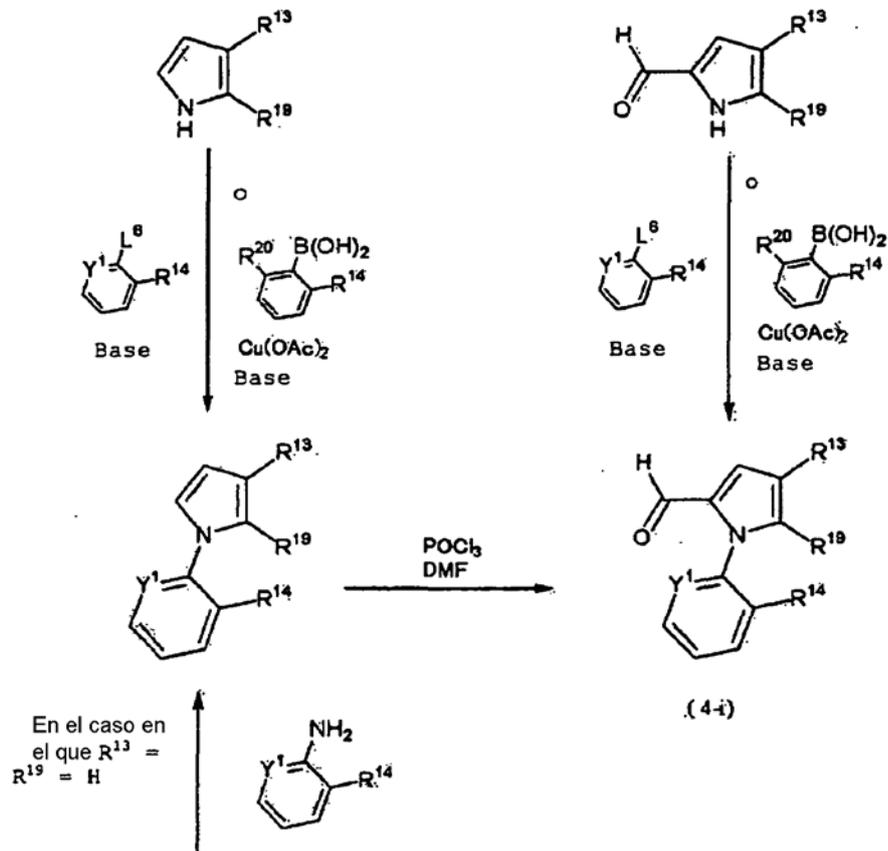
5

donde R^{13} , R^{14} , R^{19} y Y^1 se definen como antes.

Entre los compuestos (4), un compuesto (4-i) se puede producir de acuerdo con un procedimiento, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

10

[Fórmula Química 37]

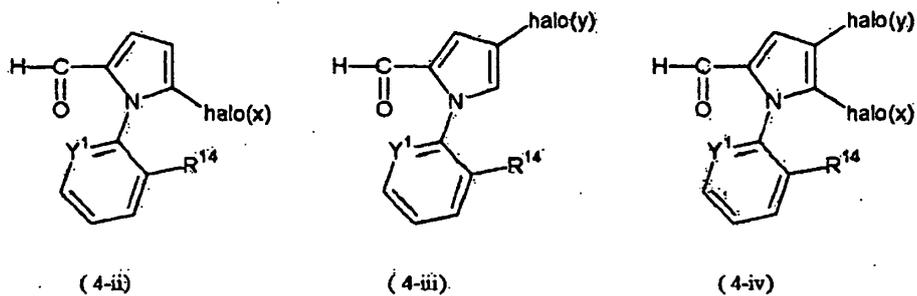


15

donde R^{13} , R^{14} , R^{19} , R^{20} , Y^1 y L^6 se definen como antes.

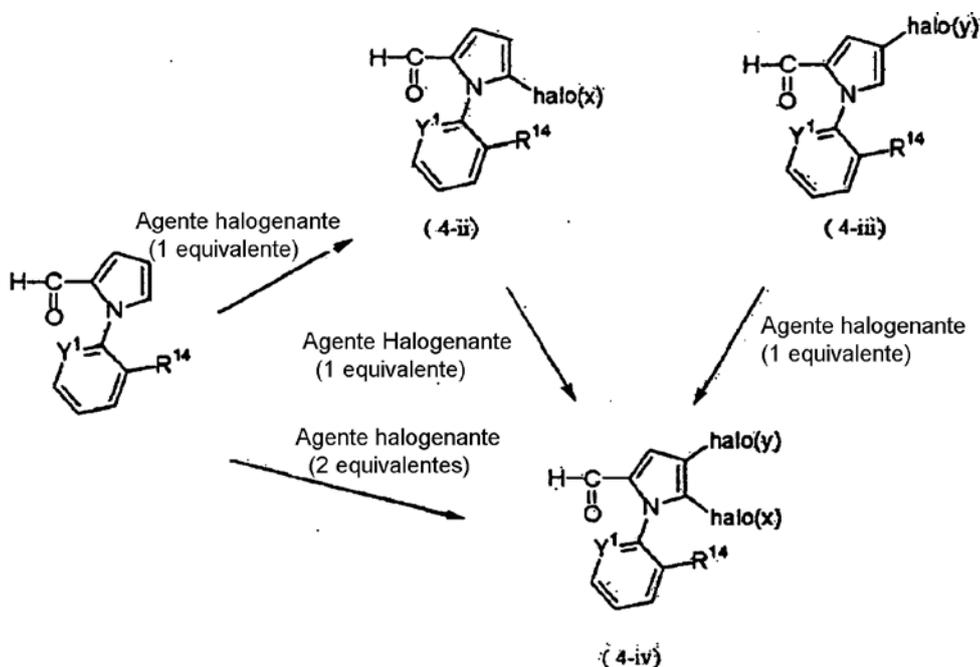
Entre los compuestos (4), los compuestos representados por la fórmula (4-ii), la fórmula (4-iii) y la fórmula (4-iv):

[Fórmula Química 38]



5 donde R¹⁴ e Y¹ se definen como antes, y cada uno de halo(x) y halo(y) representa independientemente un átomo de halógeno se puede producir de acuerdo con un procedimiento, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

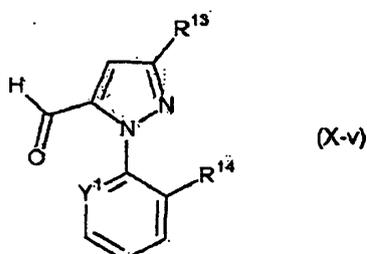
[Fórmula Química 39]



10 donde R¹⁴, Y¹, halo(x) y halo(y) se definen como antes.

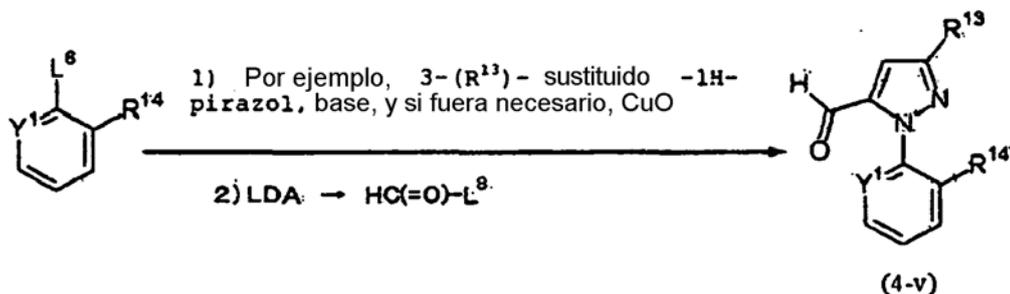
Entre los compuestos (4), un compuesto representado por la fórmula (4-v):

[Fórmula Química 40]



15 donde R¹³, R¹⁴ e Y¹ se definen como antes, se puede producir de acuerdo con un procedimiento, por ejemplo, mostrado en el siguiente esquema:

[Fórmula Química 41]

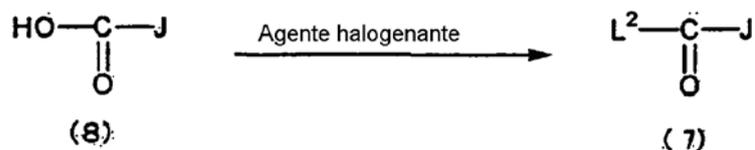


5 donde L⁶ representa un grupo eliminable (p. ej., un átomo de halógeno, y un grupo metanosulfonilo), L⁸ representa un grupo eliminable (p. ej., un grupo metoxi, un grupo etoxi, y un grupo N,N-dimetilamino) y R¹³, R¹⁴ e Y¹ se definen como antes.

El compuesto (7) se puede producir de acuerdo con el esquema siguiente:

10

[Fórmula Química 42]



15 donde L² y J se definen como antes.

Los compuestos obtenidos mediante los procedimientos descritos anteriormente se pueden aislar y purificar por medio de un método convencional tal como trituración, pulverización, recristalización, cromatografía en columna, h cromatografía en columna de alta resolución (HPLC), HPLC preparativa a presión media, cromatografía en columna de resinas con extracción de sales, o re-precipitación.

20

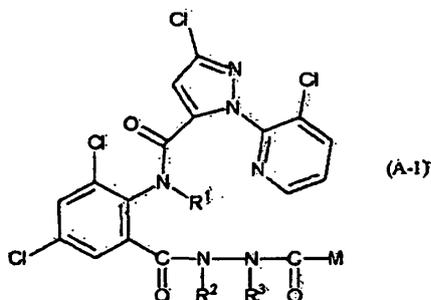
El presente compuesto se puede aislar en forma, por ejemplo, de una sal (una sal obtenida haciendo reaccionar el presente compuesto con un ácido o una base), o un solvato (p. ej., un hidrato) de acuerdo con las condiciones, y los compuestos en estas formas también están incluidos en la presente invención.

25 El presente compuesto puede existir en forma de tautómero, y el tautómero también está incluido en el presente compuesto.

Los ejemplos específicos del presente compuesto se muestran más abajo.

30 Un compuesto representado por la fórmula (A-1):

Fórmula Química 43]



35 R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Tabla 1

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
H	CH ₂ C≡CH	H	H
H	ciclopropilo	H	H
H	CH ₂ (ciclopropilo)	H	H
H	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	H	H
H	CH ₂ CN	H	H
H	CH(CH ₂)CN	H	H
H	CH ₂ OCH ₂	H	H
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	H
H	CH(CH ₃)OCH ₃	H	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂	H	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	H
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₂	H	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₂	H	H
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H	H
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	H	H
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H	H
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₂	H	H

5

Tabla 2

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H
H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	H
H	ciclopropilo	CH ₃	H
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃	H
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃	H
H	CH ₂ CN	CH ₃	H
H	CH(CH ₃)CN	CH ₃	H
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂	H
H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂	H
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂	H
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₃	H
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H

Tabla 3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	H
H	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	H
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CN	CH ₃ CH ₃	H
H	CH(CH ₃)CN	CH ₃ CH ₃	H
H	CH ₂ OCH ₂	CH ₂ CH ₂	H
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₃	H
H	CH(CH ₂)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃ OCH ₂	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₂	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ C(=C)OCH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂	H
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂	H
H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H

Tabla 4

R ¹	R ²	R ³	M
H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
H	H	CH ₂ C≡CH	H
H	H	ciclopropilo	H
H	H	CH ₂ (ciclopropilo)	H
H	H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H
H	H	CH ₃ CN	H
H	H	CH(CH ₃) CN	H
H	H	CH ₂ OCH ₃	H
H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	H	CH(CH ₃)OCH ₂	H
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
H	H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H
H	H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H
H	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
H	H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	H
H	H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H
H	H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₃	H
H	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₂	H

Tabla 5

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	H
H	CH ₃	ciclopropilo	H
H	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H
H	CH ₃	CH(CH ₃)(ciclopropilo)	H
H	CH ₃	CH ₂ CH	H
H	CH ₃	CH(CH ₃)CN	H
H	CH ₂	CH ₂ OCH ₂	H
H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H
H	CH ₂	CH ₂ CHO ₂ CH ₃	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	H
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	H
H	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂	H
H	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H

Tabla 6

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	H
H	CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CN	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₂) ₂	H
H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H

Tabla 7

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	H
H	ciclopropilo	ciclopropilo	H
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ (ciclopropilo)	H
H	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	CH(CH ₃)(ciclopropilo)	H
H	CH ₂ CN	CH ₂ CN	H
H	CH(CH ₃)CN	CH(CH ₃)CN	H
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	H
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H
H	CH ₂ CHOCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	CH ₂ CH ₂ O(CH ₂) ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ C(=O)-OCH ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	CH ₃ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₂	H

Tabla 8

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CH	H	OCH ₃
H	ciclopropilo	H	OCH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	H	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H	OCH ₃
H	CH ₂ CN	H	OCH ₂
H	CH(CH ₃)CN	H	OCH ₂
H	CH ₂ OCH ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
H	CH(CH ₃)OCH ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H	OCH ₃
H	CH=C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CH(=O)OCH ₃	H	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₂

Tabla 9

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCR ₃
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂	OCH ₃
H	ciclopropilo	CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃	OCH ₂
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CN	CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₂)CN	CH ₃	OCH ₂
H	CH ₂ OCH ₂	CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₂)OCH ₃	CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂	CH ₃	-OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OH ₂ CH ₂	CH ₃	OCH ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₂	OCH ₃
H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃

Tabla 10

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₂	OCH ₂
H	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CN	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
H	CH(CH ₃)OCH ₂	CH ₂ H ₃	OCH ₃
H	CH ₂ H ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	-OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 11

R ¹	R ²	R ³	M
H	H	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	H	ciclopropilo	OCH ₃
H	H	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	OCH ₃
H	H	CH ₂ CN	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃)CN	OCH ₃
H	H	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	H	CH(CH ₂)OCH ₂	OCH ₂
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ OH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	H	CHC(=O)OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 12

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	CH ₃	ciclopropilo	OCH ₂
H	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CN	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)CN	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ OCOC(CH ₃) ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 13

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
H	CH ₂ H ₃	CH(CH ₃)(ciclopropilo)	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CN	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₂)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃ OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₂	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 14

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	ciclopropilo	ciclopropilo	OCH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
H	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	OCH ₃
H	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CN	CH(CH ₃)CN	OCH ₃
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 15

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C≡CH	H	N(CH ₃) ₂
H	ciclopropilo	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ (ciclopropilo)	H	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CN	H	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)CN	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH(CH ₃)OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₂) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	H	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₂) ₂
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₂	H	N(CH ₃) ₂

Tabla 16

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	N(CH ₂) ₂
H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	ciclopropilo	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃ (ciclopropilo)	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CN	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)CN	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N(CH) ₂
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₂) ₂	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₂	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 17

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)CN	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₂ CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₈	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH-(CH ₂) ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 18

R ¹	R ²	R ³	M
H	H	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
H	H	ciclopropilo	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
H	H	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₂) ₃
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₂) ₂
H	H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 19

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	ciclopropilo	N(CH ₂) ₂
H	CH ₂	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N(CH ₂) ₂
H	CH ₃	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	N((CH ₃) ₂)
H	CH ₂	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	N(CH ₂) ₂
H	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 20

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	N(CH ₂) ₂
H	CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₃	CN(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 21

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
H	ciclopropilo	ciclopropilo	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CN	CH ₂ CH	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)CN	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₂ OCH ₃ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃ CH ₃	N(CH ₂) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	N(CH ₃) ₂
H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 22

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CH ₃	CH ₂ C≡CH	H	H
CH ₃	ciclopropilo	H	H
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H	H
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H	H
CH ₃	CH ₂ CN	H	H
CH ₃	CH(CH ₃)CN	H	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	H
CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	H

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	H

Tabla 23

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H
CH ₂	CH ₂ C≡CH	CH ₃	H
CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)(ciclopropilo)	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃ CN	CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)CN	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	H
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₂	CH ₃	H

Tabla 24

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	H
CH ₂	CH(CH ₃)CN	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	H
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	CH ₂ CH ₂	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CR ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H

Tabla 25

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₃	H	CH ₃ C≡CH	H
CH ₂	H	ciclopropilo	H
CH ₃	H	CH ₂ (ciclopropilo)	H
CH ₂	H	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	H
CH ₃	H	CH ₂ CN	H
CH ₃	H	CH(CH ₃)CN	H
CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	H
CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	H	CH(CH ₃)OCH ₃	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	H
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	H
CH ₃	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H
CH ₃	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H

Tabla 26

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	H
CH ₃	CH ₃	ciclopropilo	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	H
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CN	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₂) ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	H
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H
CH ₃	CH ₂	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂	H
CH ₂	CH ₂	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H

Tabla 27

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂	CH ₂ C≡CH	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂	ciclopropilo	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H
CH ₂	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CN	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₂)OCH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃ CH ₃	H
CH ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₄) ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₂	H

Tabla 28

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₃	CH ₂ C≡CH.	CH ₂ C=CH	H.
CH ₂	ciclopropilo	ciclopropilo	H
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ (ciclopropilo)	H
CH ₃	CH(CH ₂)(ciclopropilo)	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H
CH ₂	CH ₂ CN	CH ₂ CN	H
CH ₃	CH(CH ₃)CN	CH(CH ₃)CN	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₂	CH ₂ OCH ₃	H
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ O(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂	CH ₂ C(=O)OCH ₂	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCHCH ₃	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₂) ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₂	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂	H
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H

Tabla 29

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C≡CH	H	OCH ₂
CH ₃	ciclopropilo	H	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CN	H	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)CN	H	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ OCH ₂	H	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₂)OCH ₂	H	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₂) ₂	H	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₂	H	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₂	H	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	H	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₃

Tabla 30

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₃	CH ₃	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)CN	CH ₃	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₂)OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₃	OCH ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₂

Tabla 31

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	Ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)CN	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ OCH ₂	CH ₂ CH ₂	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂	CH ₂ CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)(CH ₂) ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₂
CH ₂	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 32

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	H	CH ₂ H=CH ₂	OCH ₂
CH ₃	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
CH ₂	H	ciclopropilo	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃)(ciclopropilo)	OCH ₂
CH ₃	H	CH ₂ CN	OCH ₂
CH ₃	H	CH(CH ₃)CN	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	OCH ₂
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
CH ₂	H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	H	CH(CH ₂)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 33

R ¹	R ²	R ³	M.
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	ciclopropilo	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	OCH ₂
CH ₂	CH ₃	CH ₂ CN	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CN	OCH ₃
CH ₃	CH ₂	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M.
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	OCH ₂
CH ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
CH ₂	CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 34

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₂) (ciclopropilo)	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CN	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₂)CN	OCH ₈
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₈	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ PH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=C)OCH(CH ₃) ₂	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	CH=CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₈

Tabla 35

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃
CH ₃	ciclopropilo	ciclopropilo	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CN(CH ₃) (ciclopropilo)	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OCH ₃
CH ₈	CH(CH ₃)CN	CH(CH ₂)CN	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₂	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH(CH ₃)OCH ₂	CH(CH ₃)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₂) ₂	OCH ₃
CH ₂	CH=CH ₂ OC(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₂	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₂) ₃	CH=C(=O)OC(CH ₃) ₃	OCH ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 36

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₃ ≡CH	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	ciclopropilo	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH ₂ CN	H	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH(CH ₃)CN	H	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₂)OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂	H	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂

Tabla 37

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CN	CH ₂	N(CH ₃) ₃
CH ₂	CH(CH ₃)CN	CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₈ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH(CH ₃)OCH ₂	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂	N(CH ₂) ₂
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CB ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₂	CH ₂	N(CH ₃) ₂

Tabla 38

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₃
CH ₃	ciclopropilo	CH ₂ CH ₈	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₂	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH(CH ₂)CN	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₈	CH ₂ OCH ₂	CH ₄ CH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₈	N(CH ₂) ₂
CH ₈	CH(CH ₃)OCH ₂	CH ₂ CH ₈	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₂) ₃
CH ₈	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₂) ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CX ₂ X ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	N(CH ₂) ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₂	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH ₂ H ₃	N(CH) ₃ /2
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 39

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	ciclopropilo	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₂) ₂
CH ₃	H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₃
CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₂	H	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₂) ₂
CH ₃	H	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 40

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	ciclopropilo	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ M ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ H ₂ OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CN) ₂

Tabla 41

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₂	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH=CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃ CH ₃	CH (CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 42

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	N(CH ₃) ₂
CH ₃	ciclopropilo	ciclopropilo	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₂ (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CN	CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃)CN	CH(CH ₃)CN	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₂	N(CH ₂) ₂
CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃ OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃)	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₃
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₂	CH ₂ C(=O)OCH(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	CH ₂ C(=O)OC(CH ₃) ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C(=O)OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂

Tabla 43

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHCH ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ CCl=CH ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHCl	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CCl ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ CBr=CH ₂	H	OCR ₃
H	CH ₂ CH=CHBr	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CBr ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H	OCH ₃
H	CH ₂ C=CCH ₃	H	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CCl	H	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CBr	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	H	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C≡CH	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OH	H	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	OCH ₃
H	CH ₂ CH(CH ₃)OH	H	OCH ₃

Tabla 44

R ¹	R ²	R ³	M
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃

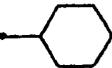
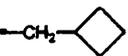
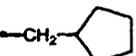
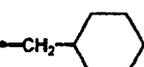
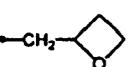
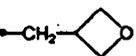
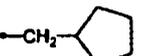
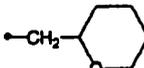
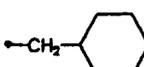
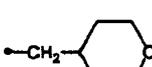
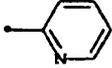
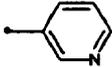
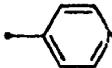
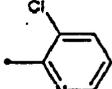
R ¹	R ²	R ³	M
			
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃

Tabla 45

R ¹	R ²	R ³	M
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃

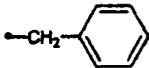
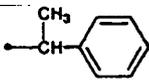
R ¹	R ²	R ³	M
			
H		H	OCH ₃

Tabla 46

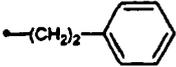
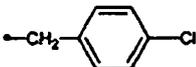
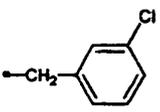
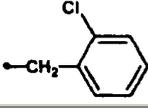
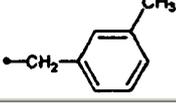
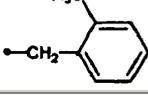
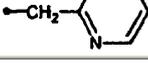
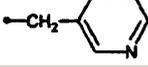
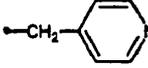
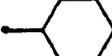
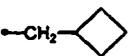
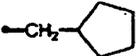
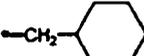
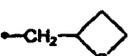
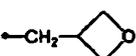
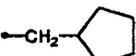
R ¹	R ²	R ³	M
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃
H		H	OCH ₃

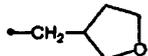
Tabla 47

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CCl=CH ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHCl	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CCl ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CBr=CH ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHBr	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CBR ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CCH ₃	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CCl	CR ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CBr	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C≡CH	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CH ₂ OH	CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH(CH ₃)OH	CH ₃	OCH ₃

Tabla 48

R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃

R ¹	R ²	R ³	M
			

[0245]
Tabla 49

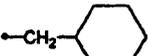
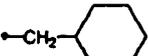
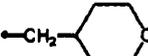
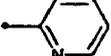
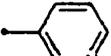
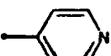
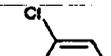
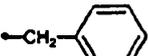
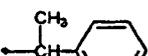
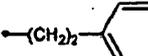
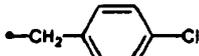
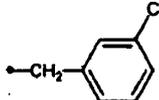
R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃

Tabla 50

R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃

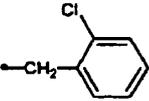
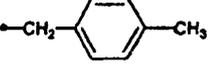
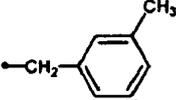
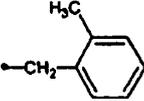
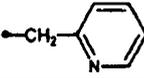
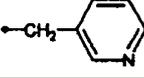
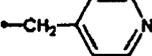
R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃
H		CH ₃	OCH ₃

Tabla 51

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CCl=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHCl	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CCl ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CBr=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CHBr	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH=CBr ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CCH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CCl	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ C≡CBr	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH(CH ₃)C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH(CH ₃)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH(CH ₃)OH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 52

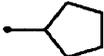
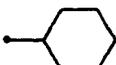
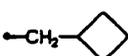
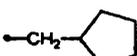
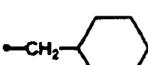
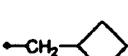
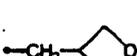
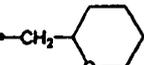
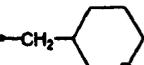
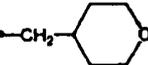
R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 53

R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃

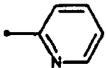
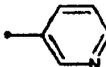
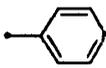
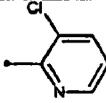
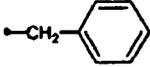
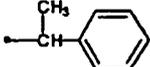
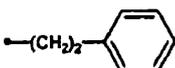
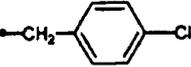
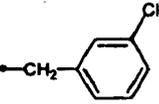
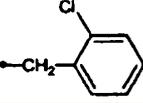
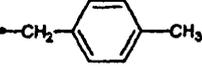
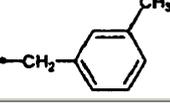
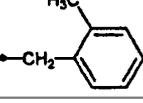
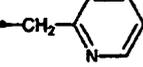
R ¹	R ²	R ³	M
			
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 54

R ¹	R ²	R ³	M
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃

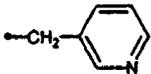
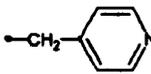
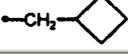
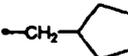
R ¹	R ²	R ³	M
			
H		CH ₂ CH ₃	OCH ₃

Tabla 55

R ¹	R ²	R ³	M
H	H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CCl=CH ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH=CHCl	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH=CCl ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CBr=CH ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH=CHBr	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH=CBr ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂	OCH ₃
H	H	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃
H	H	CH ₂ C≡CCl	OCH ₃
H	H	CH ₂ C≡CBr	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃)C≡CH	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH ₂ OH	OCH ₃
H	H	CH(CH ₃)CH ₂ OH	OCH ₃
H	H	CH ₂ CH(CH ₃)OH	OCH ₃

Tabla 56

R ¹	R ²	R ³	M
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃

R ¹	R ²	R ³	M
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃

Tabla 57

R ¹	R ²	R ³	M
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃

Tabla 58

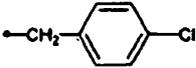
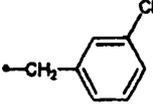
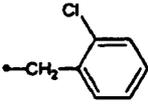
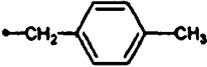
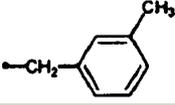
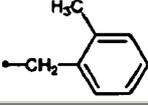
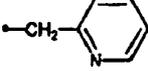
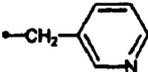
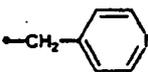
R ¹	R ²	R ³	M
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃
H	H		OCH ₃

Tabla 59

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CCl=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=CHCl	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CBr=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=CHBr	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=CBr ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃	CH ₂ C≡CCl	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C≡CBr	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OH	OCH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ H	OCH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH (CH ₃) OH	OCH ₃

Tabla 60

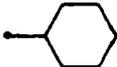
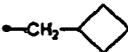
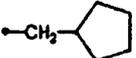
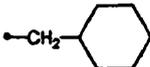
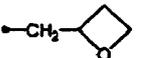
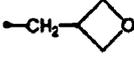
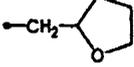
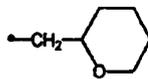
R ²	R ²	R ³	M
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃

Tabla 61

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃		OCH ₃

ES 2 389 965 T3

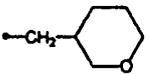
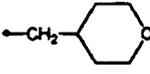
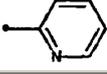
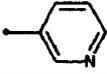
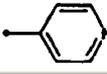
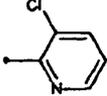
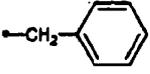
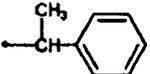
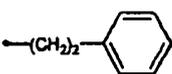
R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃

Tabla 62

R ²	R ²	R ³	M
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃
H	CH ₃		OCH ₃

Tabla 63

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CCl=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHCl	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CBr=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CHBr	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH-CBr ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃

ES 2 389 965 T3

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CCl	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CBr	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OH	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OH	OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃)OH	OCH ₃

Tabla 64

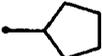
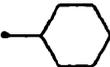
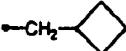
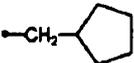
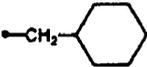
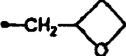
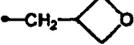
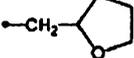
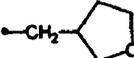
R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃

Tabla 65

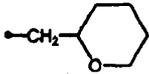
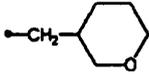
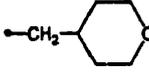
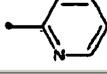
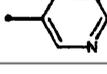
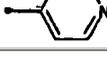
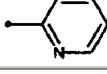
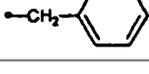
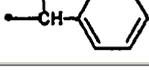
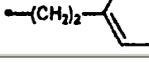
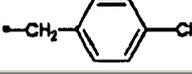
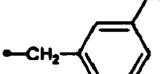
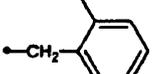
R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃

Tabla 66

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃

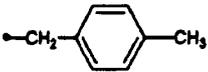
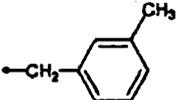
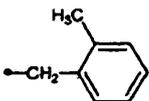
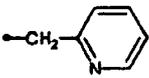
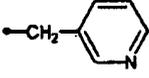
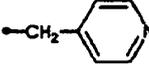
R ¹	R ²	R ³	M
			
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃
H	CH ₂ CH ₃		OCH ₃

Tabla 67

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃
H	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃
H	Ciclopropilo	H	CH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	H	CH ₃
H	CH (CH ₃) (ciclopropilo)	H	CH ₃
H	CH ₂ CN	H	CH ₃
H	CH(CH ₃)CN	H	CH ₃
H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
H	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃
H	H	Ciclopropilo	CH ₃
H	H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃
H	H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃
H	H	CH ₂ CN	CH ₃
H	H	CH (CH ₃) CN	CH ₃
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃
H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃
H	Ciclopropilo	CH ₃	CH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃	CH ₃
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃	CH ₃
H	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃
H	CH(CH ₃)CN	CH ₃	CH ₃

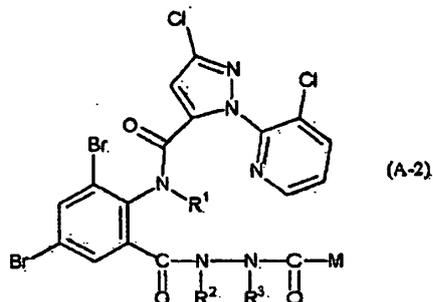
R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₃
H	CH ₃	Ciclopropilo	CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)CN	CH ₃

Tabla 68

R ¹	R ²	R ³	M
H	CH ₂ CH=CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ C≡CH	H	OCH ₂ CH ₃
H	Ciclopropilo	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ CN	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH (CH ₃) CN	H	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₃
H	H	Ciclopropilo	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH (CH ₃) CN	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Ciclopropilo	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ (ciclopropilo)	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	CH(CH ₃) (ciclopropilo)	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₂ CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	CH (CH ₃)CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	Ciclopropilo	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ (ciclopropilo)	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)(ciclopropilo)	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃)CN	OCH ₂ CH ₃

Un compuesto representado por la fórmula (A-2):

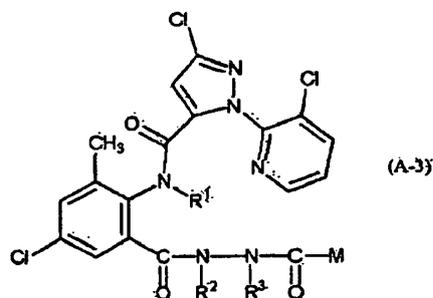
[Fórmula Química 44]



R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5 Un compuesto representado por la fórmula (A-3):

[Fórmula Química 45]

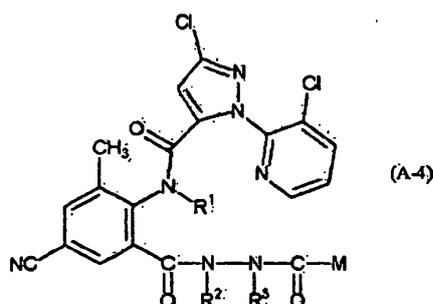


10 R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-4):

15

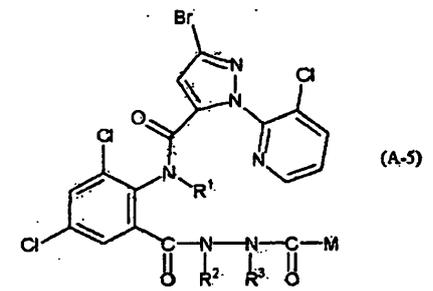
[Fórmula Química 46]



R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

20 Un compuesto representado por la fórmula (A-5):

[Fórmula Química 47]

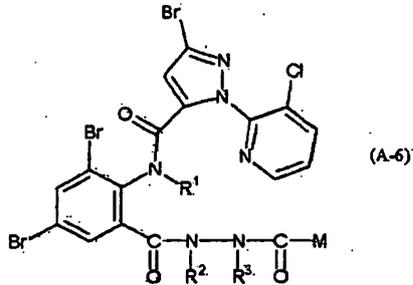


R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-6):

5

[Fórmula Química 48]

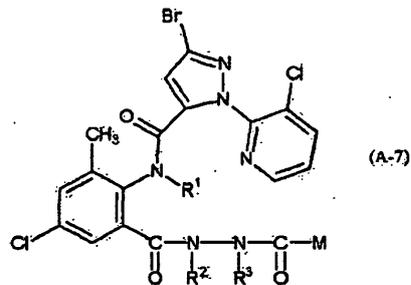


R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (A-7):

[Fórmula Química 49]



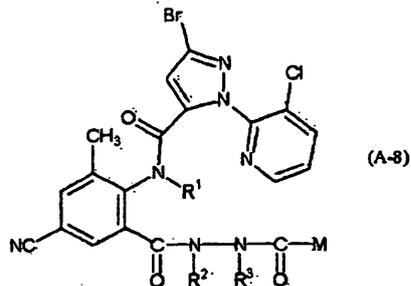
15

R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-8):

20

[Fórmula Química 50]

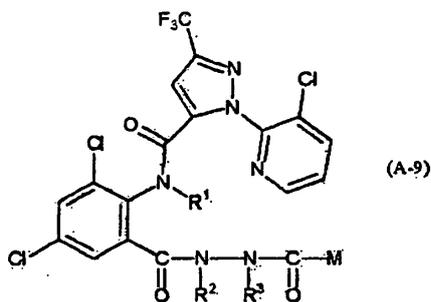


R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

25

Un compuesto representado por la fórmula (A-9):

[Fórmula Química 51]

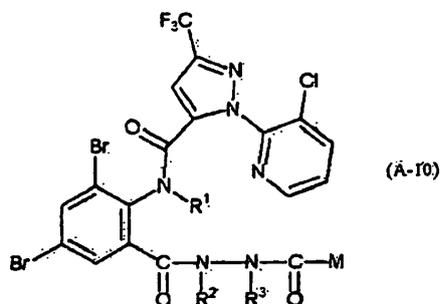


R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (A-10):

[Fórmula Química 52]



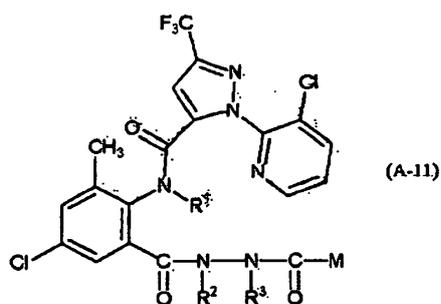
R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (A-11):

15

[Fórmula Química 53]

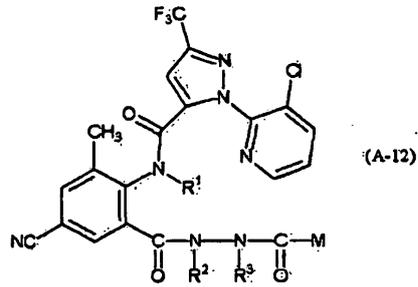


R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

20

Un compuesto representado por la fórmula (A-12):

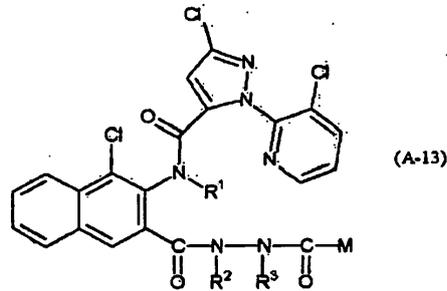
[Fórmula Química 54]



5 R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-13):

[Fórmula Química 55]



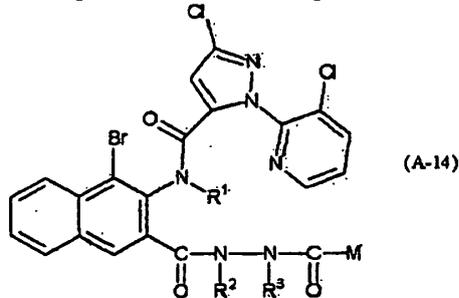
10

R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-14):

15

[Fórmula Química 56]

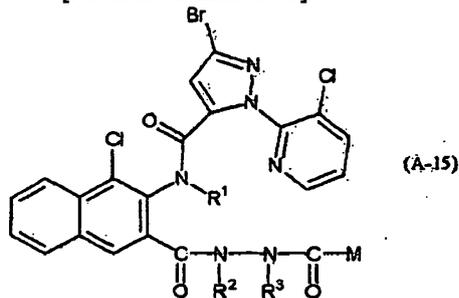


20

R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-15):

[Fórmula Química 57]

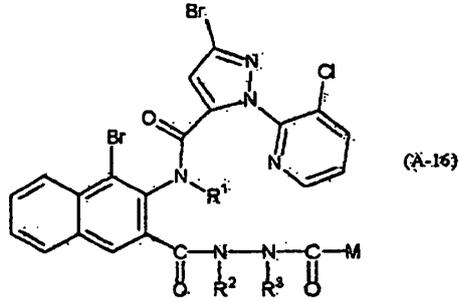


25

R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-16):

[Fórmula Química 58]



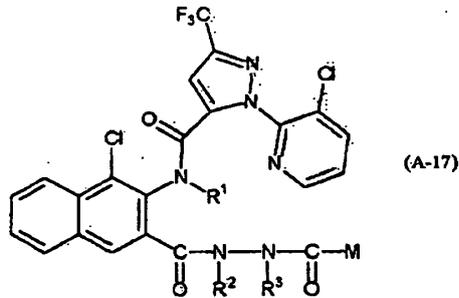
5

R¹, R², R³ y M en la fórmula representa las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-17):

10

[Fórmula Química 59]



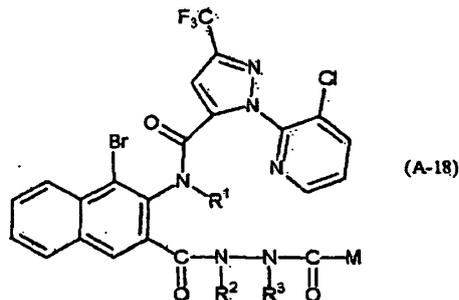
15

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-18):

20

[Fórmula Química 60]

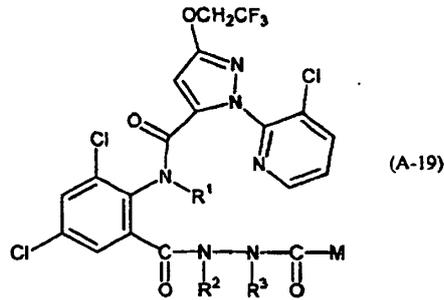


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

25

Un compuesto representado por la fórmula (A-19):

[Fórmula Química 61]

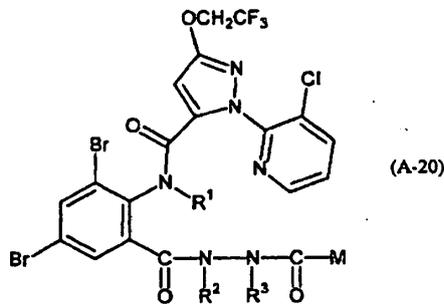


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (A-20):

[Fórmula Química 62]

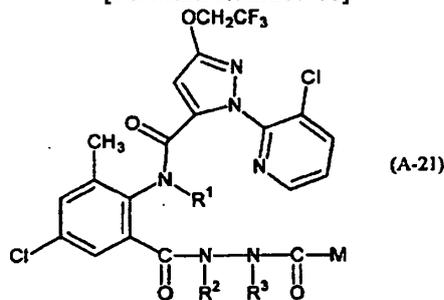


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (A-21):

[Fórmula Química 63]

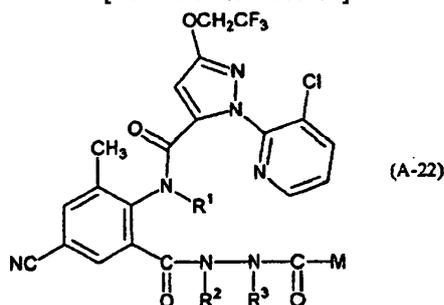


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

Un compuesto representado por la fórmula (A-22):

[Fórmula Química 64]



R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

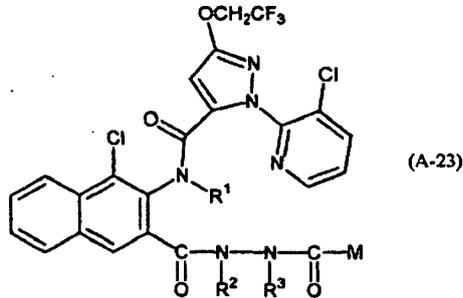
20

25

Un compuesto representado por la fórmula (A-23):

5

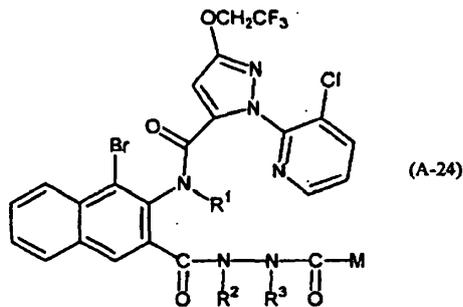
[Fórmula Química 65]



R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10 Un compuesto representado por la fórmula (A-24):

[Fórmula Química 66]



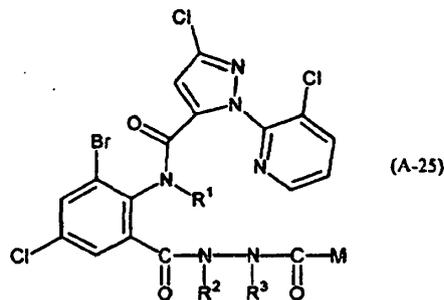
15

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-25):

20

[Fórmula Química 67]

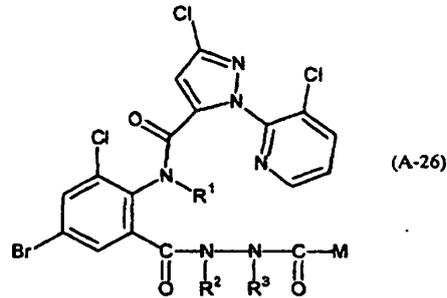


25

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (A-26):

[Fórmula Química 68]

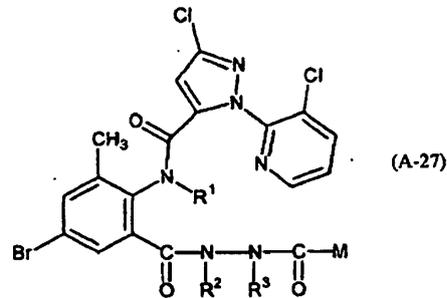


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (A-27):

[Fórmula Química 69]

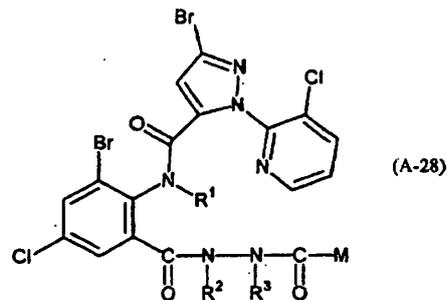


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (A-28):

[Fórmula Química 70]

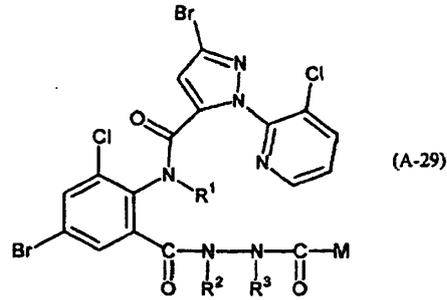


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

20

Un compuesto representado por la fórmula (A-29):

[Fórmula Química 71]

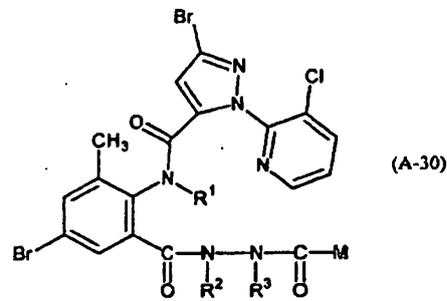


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (A-30):

[Fórmula Química 72]

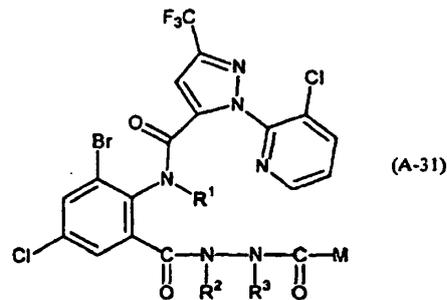


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (A-31):

[Fórmula Química 73]



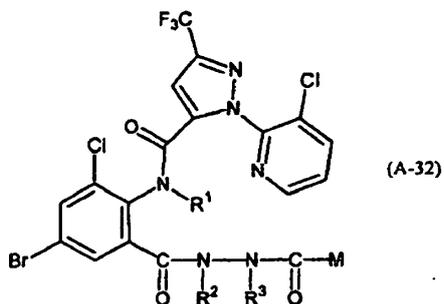
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

20

Un compuesto representado por la fórmula (A-32):

[Fórmula Química 74]

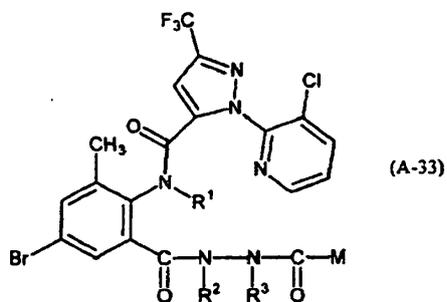


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (A-33):

[Fórmula Química 75]

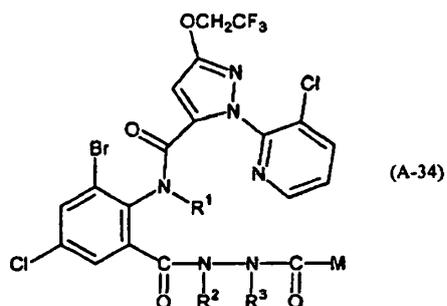


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (A-34):

[Fórmula Química 76]

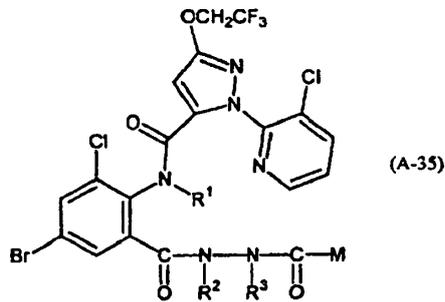


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

20 Un compuesto representado por la fórmula (A-35):

[Fórmula Química 77]

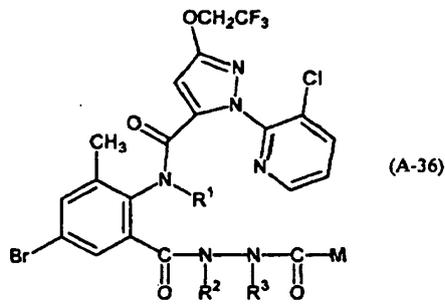


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (A-36):

[Fórmula Química 78]



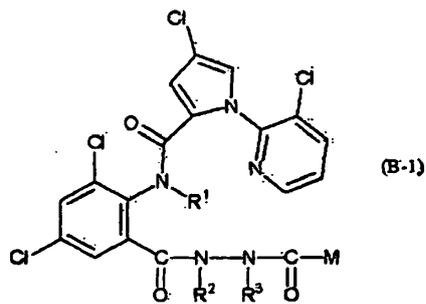
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (B-1):

15

[Fórmula Química 79]

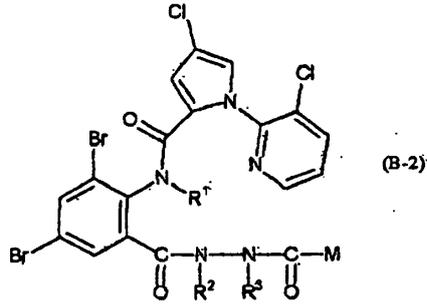


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

20

Un compuesto representado por la fórmula (B-2):

[Fórmula Química 80]

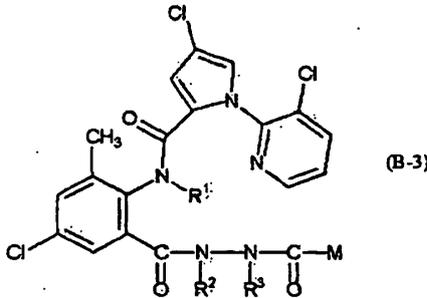


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (B-3):

[Fórmula Química 81]

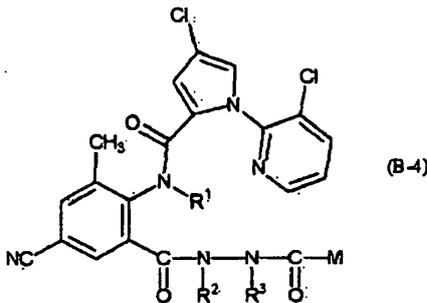


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (B-4):

[Fórmula Química 82]



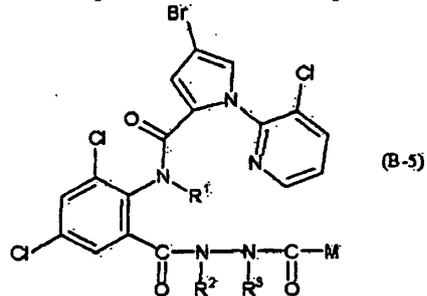
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

20

Un compuesto representado por la fórmula (B-5):

[Fórmula Química 83]

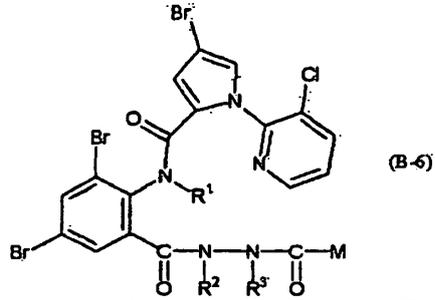


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

25

Un compuesto representado por la fórmula (B-6):

[Fórmula Química 84]

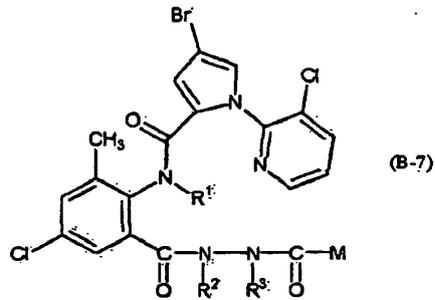


5

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-7):

[Fórmula Química 85]

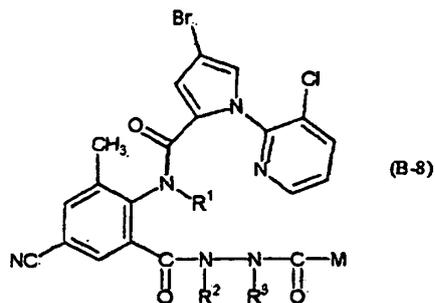


10

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-8):

[Fórmula Química 86]



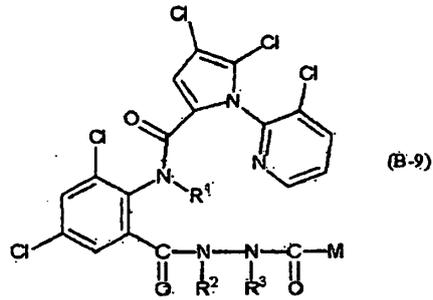
15

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-9):

25

[Fórmula Química 87]

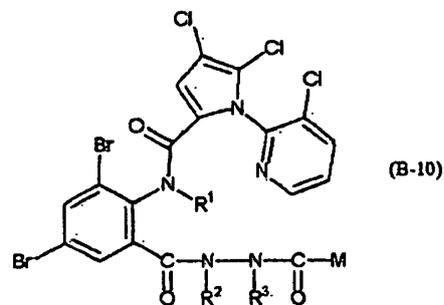


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (B-10):

[Fórmula Química 88]

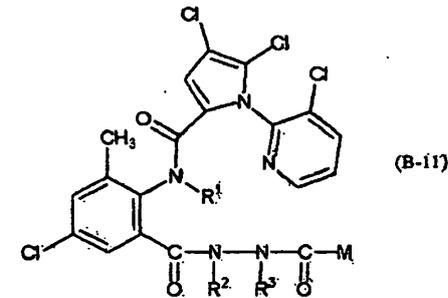


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (B-11):

[Fórmula Química 89]



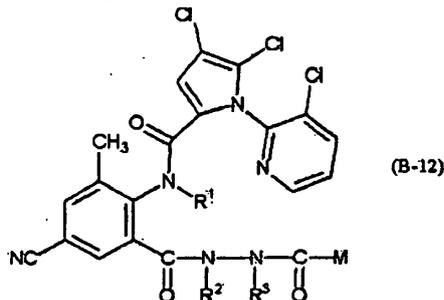
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

Un compuesto representado por la fórmula (B-12):

20

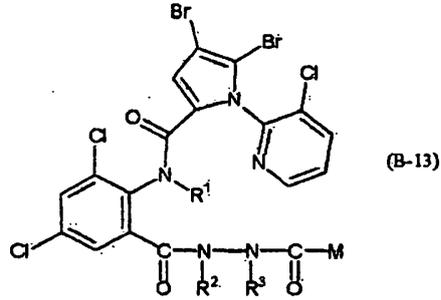
[Fórmula Química 90]



R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-13):

[Fórmula Química 91]

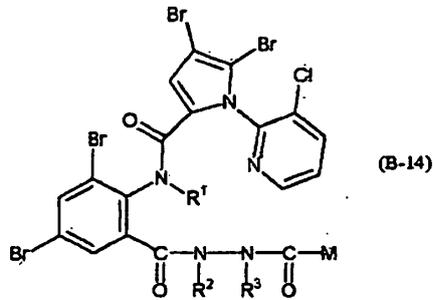


5

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-14):

[Fórmula Química 92]

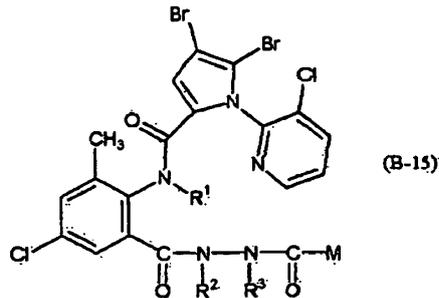


10

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-15):

[Fórmula Química 93]



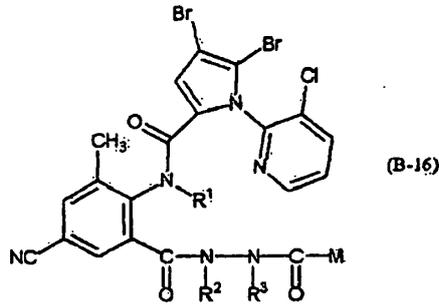
15

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (B-16):

20

[Fórmula Química 94]

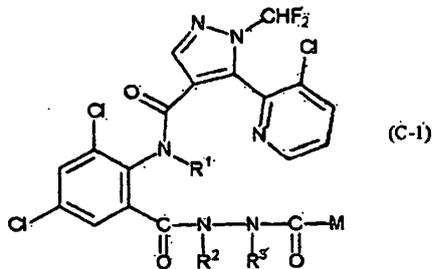


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (C-1):

[Fórmula Química 95]

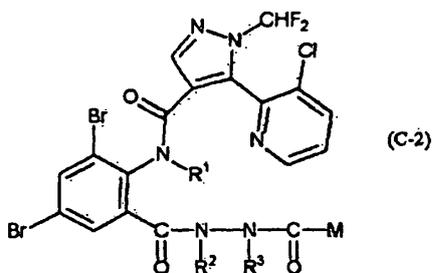


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (C-2):

[Fórmula Química 96]



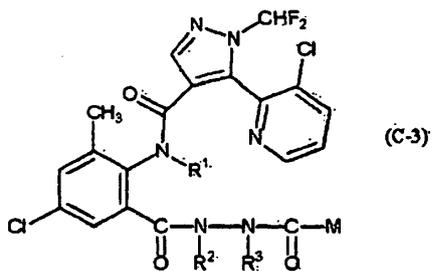
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

20

Un compuesto representado por la fórmula (C-3):

[Fórmula Química 97]

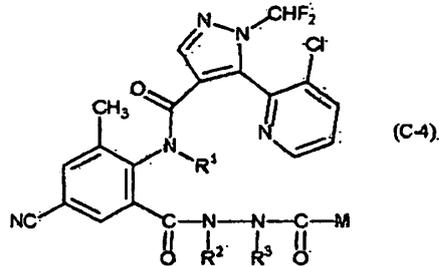


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

25

Un compuesto representado por la fórmula (C-4):

[Fórmula Química 98]

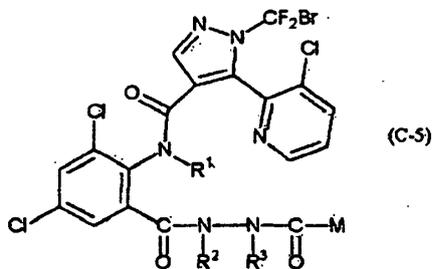


5

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-5):

[Fórmula Química 99]

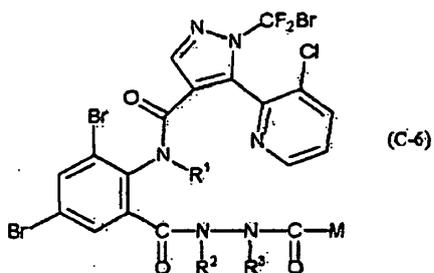


10

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-6):

[Fórmula Química 100]

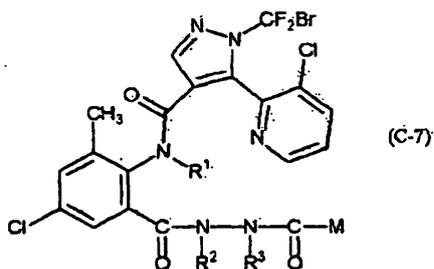


20

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-7):

[Fórmula Química 101]

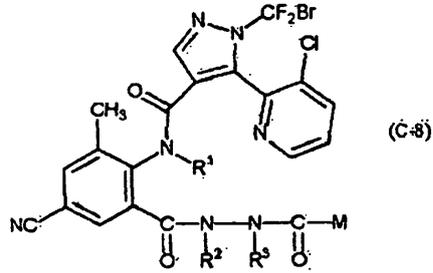


25

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-8):

[Fórmula Química 102]



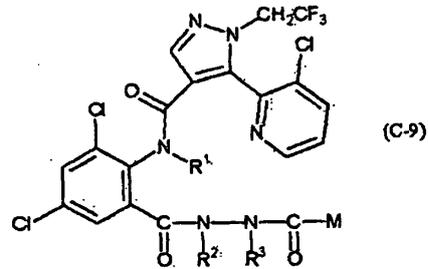
5

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-9):

10

[Fórmula Química 103]

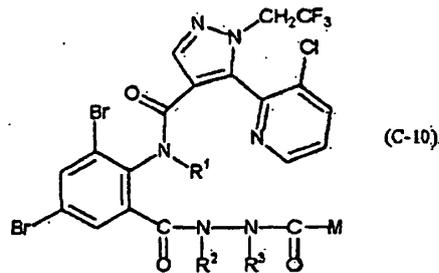


15

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-10):

[Fórmula Química 104]

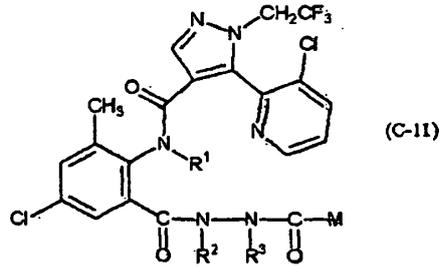


20

R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

Un compuesto representado por la fórmula (C-11):

[Fórmula Química 105]

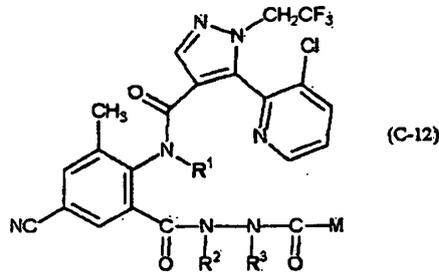


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (C-12):

[Fórmula Química 106]

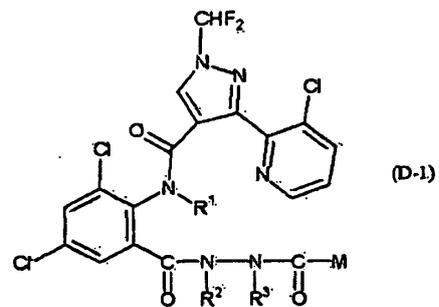


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (D-1):

[Fórmula Química 107]

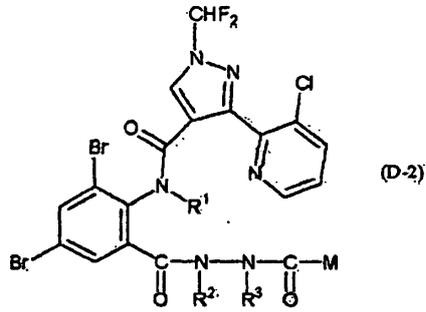


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

20

Un compuesto representado por la fórmula (D-2):

[Fórmula Química 108]

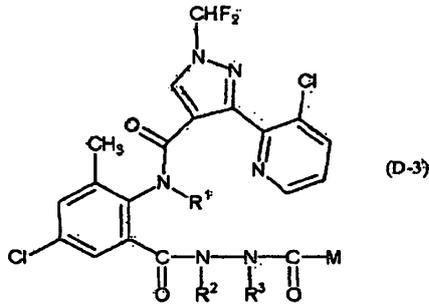


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (D-3):

[Fórmula Química 109]

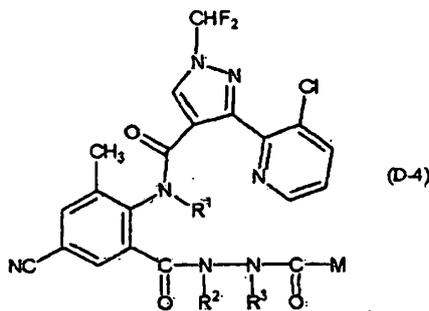


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (D-4):

[Fórmula Química 110]

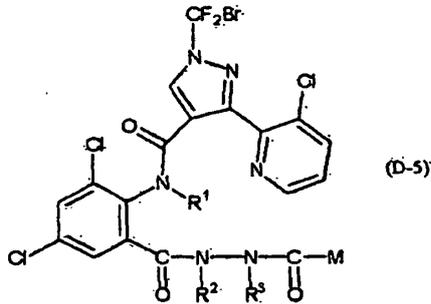


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

20

Un compuesto representado por la fórmula (D-5):

[Fórmula Química 111]

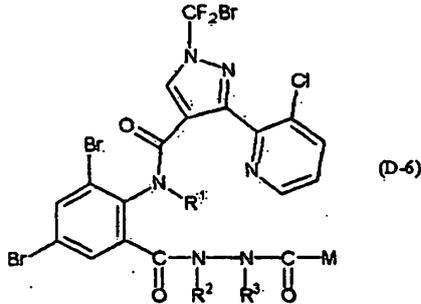


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (D-6):

[Fórmula Química 112]

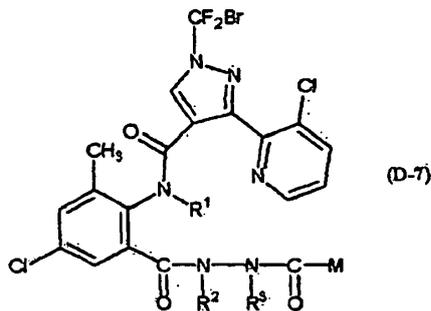


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (D-7):

[Fórmula Química 113]



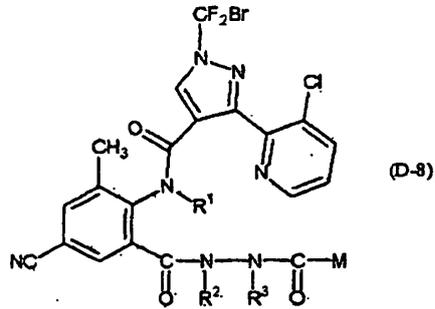
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

20

Un compuesto representado por la fórmula (D-8):

[Fórmula Química 114]

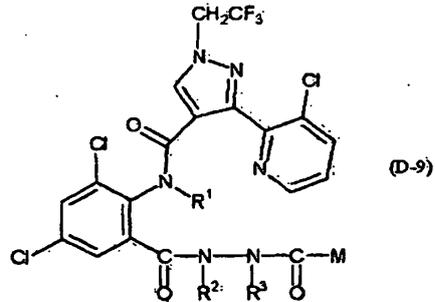


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (D-9):

[Fórmula Química 115]

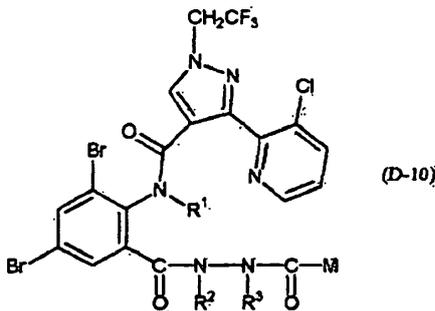


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Un compuesto representado por la fórmula (D-10):

[Fórmula Química 116]



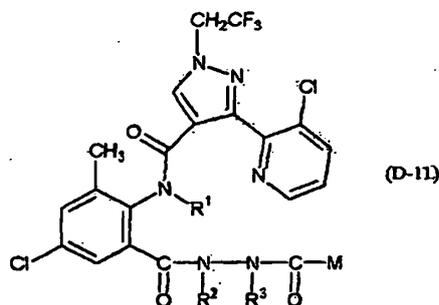
R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

15

20

Un compuesto representado por la fórmula (D-11):

[Fórmula Química 117]

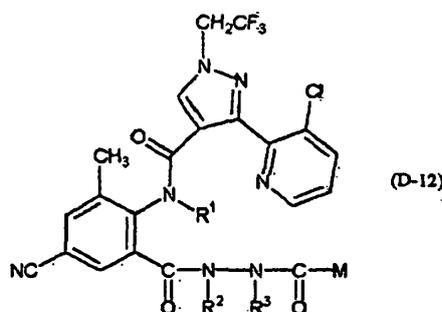


R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

5

Un compuesto representado por la fórmula (D-12):

[Fórmula Química 118]



R¹, R², R³ y M en la fórmula representan las combinaciones descritas en la Tabla 1 a la Tabla 68.

10

Los artrópodos nocivos contra los cuales el agente para el control de artrópodos nocivos que contiene el presente compuesto como agente activo exhibe un efecto de control incluyen, por ejemplo, insectos nocivos y ácaros nocivos, y sus ejemplos específicos incluyen los siguientes.

15

Hemiptera:

Saltadores de plantas (Delphacidae) tales como el saltador de plantas pardo pequeño (*Laodelphax striatellus*), el saltador de plantas pardo del arroz (*Nilaparvata lugens*), y el saltador de plantas de dorso blanco del arroz (*Sogatella furcifera*); saltadores de hojas (Deltocephalidae) tales como el saltador de hojas verde del arroz (*Nephotettix cincticeps*), el saltador de hojas verde del arroz (*Nephotettix virescens*), y el saltador de hojas verde del té (*Empoasca onukii*); áfidos (Aphididae) tales como el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), el pulgón de la col (*Brevicorine brassicae*), el pulgón verde de los cítricos (*Aphis spiraecola*), el pulgón de la patata (*Macrosiphum euphorbiae*), el pulgón de las solanáceas (*Aulacorthum solani*), el pulgón de la avena (*Rhopalosiphum padi*), el pulgón tropical de los cítricos (*Toxoptera citricidus*), y el pulgón harinoso del ciruelo (*Hyalopterus pruni*); chinches hediondas (Pentatomidae) tales como la chinche hedionda verde (*Nezara antennata*), la chinche de las alubias (*Riptortus clavetus*), la chinche del arroz (*Leptocoris chinensis*), la chinche espinosa de manchas blancas (*Eysarcoris parvus*), y la chinche marrón marmórea (*Halyomorpha mista*); moscas blancas (Aleyrodidae) tales como la mosca blanca (*Trialeurodes vaporariorum*), la mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), la mosca blanca de los cítricos (*Dialeurodes citri*), y la mosca blanca espinosa de los cítricos (*Aleurocanthus spiniferus*); cochinillas (Coccidae) tales como la cochinilla roja de California (*Aonidiella aurantii*), la cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciosa*), la cochinilla blanca (*Unaspis citri*), la escama roja (*Ceroplastes rubens*), la cochinilla acanalada (*Icerya purchasi*), la cochinilla harinosa (*Planococcus kraunhiae*), el gorgojo de Cosmstock (*Pseudococcus longispinis*), y la cochinilla blanca del melocotonero (*Pseudaulacaspis pentagona*); chinches de encaje (Tingidae); cimices tales como *Cimex lectularius*; psílidos (Psillidae), etc.;

20

25

30

35

Lepidoptera:

Pollillas pirápidas (Pyralidae) tales como el barrenador del tallo del arroz (*Chilo suppressalis*), el barrenador amarillo del arroz (*Tryporyza incertulas*), el enrollahojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), el enrollahojas del algodón

40

(*Notarcha derogata*), la polilla India de la harina (*Plodia interpunctella*), *Ostrinia furnacalis*, el gusano del brote de la col (*Hellula undalis*), y la oruga de la grama de los prados (*Pediasia teterrellus*); polillas mochuelo (Noctuidae) tales como el gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*), la rosquilla verde el gusano de la remolacha (*Spodoptera exigua*), la oruga del arroz (*Pseudaletia separata*), la oruga de la col (*Mamestra brassicae*), el gusano cortador (*Agrotis ipsilon*), el gusano de la remolacha (*Plusia nigrisigna*), *Thoricoplusia* spp., *Heliotis* spp., y *Helicoverpa* spp.; mariposas blancas (Pieridae) tales como la blanquita de la col (*Pieris rapae*); polillas tortricidas (Tortricidae) tales como *Adoxophyes* spp., la polilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta*), el minador de la vaina de la soja (*Leguminivora glycinivorella*), el gusano de la vaina de la judía azuki (*Matsumuraeses azukivora*), el tórtrix de la fruta de verano (*Adoxophyes orana fasciata*), el tórtrix menor del té (*Adoxophyes* sp.), el tórtrix oriental del té (*Homona magnanima*), el enrollador de la hoja del manzano (*Archips fuscocupreanus*), y la polilla del manzano (*Cydia pomonella*); minadores de las hojas (Gracillariidae) tales como el enrollahojas del té (*Caloptilia theivora*), y el minador de las hojas del manzano (*Phyllonorycter ringoneella*); Carposinidae tales como polilla del melocotón (*Carposina niponensis*); polillas lionétidas (Lyonetiidae) tales como *Lyonetia* spp.; polillas tussock (Lymantriidae) tales como *Lymantriaspp.*, y *Euproctis* spp.; polillas yponoméutidas (Yponomeutidae) tales como la polilla dorso de diamante (*Plutella xilostella*); polillas gelequidas (Gelechiidae) tales como el gusano rosado del algodón (*Pectinophora gossypiella*), y la polilla de la patata (*Phthorimaea operculella*); polillas tigre y allies (Arctiidae) tales como el gusano de otoño de la col (*Hyphantria cunea*); polillas tineidas (Tineidae) tales como la polilla de las maletas (*Tinea translucens*), y la polilla de la ropa (*Tineola bisselliella*), etc.;

20 **Thysanoptera:**

Trips de los cítricos (*Frankliniella occidentalis*), trips del melón (*Thrips palmi*), trips amarillo del té (*Scirtothrips dorsalis*), trips de la cebolla (*Thrips tabaci*), trips de las flores (*Frankliniella intonsa*), etc.;

25 **Diptera:**

Mosca doméstica (*Musca domestica*), mosquito común (*Culex pipiens pallens*), tábano común (*Tabanus trigonus*), mosca de cebolla (*Hilemya antiqua*), mosca del maíz (*Hilemya platura*), *Anopheles sinensis*, mosca minadora del arroz (*Agromyza oryzae*), minador del follaje del arroz (*Hydrellia griseola*), gusano del tallo del arroz (*Chlorops oryzae*), mosca del melón (*Dacus cucurbitae*), mosca Mediterránea de fruta (*Ceratitis capitata*), minador de las hojas de las legumbres (*Liriomyza trifolii*), minador de las hojas del tomate (*Liriomyza sativae*), díptero minador de las hojas (*Chromatomyia horticola*), etc.;

35 **Coleoptera:**

La mariquita de veintiocho puntos (*Epilachna vigintioctopunctata*), escarabajo de las hojas de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), escarabajo de las hojas del arroz (*Oulema oryzae*), gorgojo del arroz (*Echinocnemus squameus*), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), gorgojo del algodónero (*Anthonomus grandis*), gorgojo de judía adzuki (*Callosobruchus chinensis*), picudo cazador (*Sphenophorus venatus*), escarabajo Japonés (*Popillia japonica*), escarabajo cobrizo (*Anomala cuprea*), gusanos de raíz del maíz (*Diabrotica* spp.), escarabajo de patata (*Leptinotarsa decemlineata*), gusanos del alambre (*Agriotes* spp.), escarabajo del tabaco (*Lasioderma serricorne*), escarabajo de las alfombras (*Anthrenus verbasci*), gorgojo castaño de harina (*Tribolium castaneum*), escarabajo del serrín (*Lyctus brunneus*), taladro de manchas blancas (*Anoplophora malasiaca*), escarabajo de los brotes del pino (*Tomicus piniperda*), etc.;

45 **Orthoptera:**

La langosta migratoria (*Locusta migratoria*), alacrán cebollero (*Gryllotalpa africana*), pulgón del arroz (*Oxya yezoensis*), saltamontes del arroz (*Oxya japonica*), etc.;

50 **Hymenoptera:**

Avispa de la remolacha (*Athalia rosae*), hormiga cortadora (*Acromyrmex* spp.), hormiga de fuego (*Solénopsis* spp.), etc.;

55 **Blattodea:**

Cucaracha alemana (*Blattella germanica*), cucaracha "smokybrown" (*Periplaneta fuliginosa*), cucaracha americana (*Periplaneta americana*), cucaracha parda (*Periplaneta brunnea*), cucaracha oriental (*Blatta orientalis*), etc.;

60

Ácaros araña (Tetranychidae), tales como la arañuela roja (*Tetranychus urticae*), la arañuela de kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), el ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), el ácaro rojo Europeo (*Panonychus ulmi*), y *Oligonychus* spp.; ácaros eriófidos (Eriophyidae), tales como el ácaro rosa del pardeamiento de los cítricos (*Aculops pelekassi*); *Phillocoptuta citri*, el ácaro del bronceado del tomate (*Aculops lycopersici*), el ácaro púrpura del té (*Calacarus carinatus*), el ácaro rosa de la herrumbre del té (*Acapilla theavagran*), y *Eriophyes chibaensis*; ácaros tarsonémidos (Tarsonemidae), tales como el ácaro blanco (*Polyphagotarsonemus latus*); falsos ácaros araña (Tenuipalpidae); Tuckerellidae; garrapatas (Ixodidae) tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Boophilus microplus*, y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros acáridos (Acaridae), tales como el ácaro de almacenamiento (*Tyrophagus putrescentiae*), y *Tyrophagus similis*; ácaros del polvo doméstico (Pyroglyphidae), tales como *Dermatophagoides farinae* y *Dermatophagoides pteronyssus*; y ácaros queilétidos (Cheyletidae), tales como *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis* y *Cheyletus moorei*; ácaros parasitoides tales como el ácaro rojo de las gallinas (*Dermanyssus gallinae*); etc.

El agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención puede ser el presente compuesto tal cual. No obstante, éste se formula normalmente en formulaciones tales como productos concentrados emulsionables, soluciones oleosas, espolvoreables, gránulos, polvos mojables, formulaciones en pasta líquida, polvos mojables, formulaciones en microcápsulas, aerosoles, fumigantes, cebos envenenados, o formulaciones de resina mezclando el presente compuesto con portadores inertes tales como portadores sólidos, líquidos o gaseosos, y añadiendo tensioactivos y otros agentes coadyuvantes para formulaciones si fuera necesario. Estas formulaciones contienen usualmente de 0,1 a 95% en peso del presente compuesto.

Los ejemplos del portador sólido utilizado para la formulación incluyen polvos finamente divididos o gránulos de arcilla (p. ej., arcilla de caolín, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla Fubasami, y arcilla ácida), óxido de silicio hidratado sintético, talco, cerámicas, otros minerales inorgánicos (p. ej., sericita, cuarzo, azufre, carbón activado, carbonato de calcio, y sílice hidratada), y fertilizantes químicos (p. ej., sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea, y cloruro de amonio).

Los ejemplos del portador líquido incluyen agua, alcoholes (p. ej., metanol, etanol, alcohol isopropílico, butanol, hexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol, y fenoxietanol), cetonas (p. ej., acetona, metilacetona, y ciclohexanona), hidrocarburos aromáticos (p. ej., tolueno, xileno, etilbenceno, dodecibenceno, fenilxililetano, y metilnaftaleno), hidrocarburos alifáticos (p. ej., hexano, ciclohexano, queroseno, y gasoil), ésteres (p. ej., acetato de etilo, acetato de butilo, miristato de isopropilo, oleato de etilo, adipato de diisopropilo, adipato de diisobutilo, y acetato de monometiléter de propilenglicol), nitrilos (p. ej., acetonitrilo, e isobutironitrilo), éteres (p. ej., éter diisopropílico, 1,4-dioxano, dimetiléter de etilenglicol, dimetiléter de dietilenglicol, monometiléter de dietilenglicol, monometiléter de propilenglicol, monometiléter de dipropilenglicol, y 3-metoxi-3-metil-1-butanol), amiduros de ácido (p. ej., N,N-dimetilformamida, y N,N-dimetilacetamida), hidrocarburos halogenados (p. ej., diclorometano, tricloroetano, y tetracloruro de carbono), sulfóxidos (p. ej., dimetilsulfoxido), carbonato de propileno y aceites vegetales (p. ej., aceite de soja, y aceite de semilla de algodón).

Los ejemplos del portador gaseoso incluyen fluorocarbono, gas butano, LPG (gas de petróleo licuado), dimetiléter y gas dióxido de carbono.

Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos no iónicos tales como polioxietilentalquiléter, polioxietilentalquilariléter, y éster de ácido graso y polietilenglicol; y tensioactivos aniónicos tales como alquilsulfonato, alquilbencenosulfonato, y alquilsulfato.

Los ejemplos de los otros aditivos para las formulaciones incluyen aglutinantes, dispersantes, agentes colorantes y estabilizantes, y los ejemplos específicos de los mismos incluyen caseína, gelatina, sacáridos (p. ej., almidón, goma arábica, derivados de celulosa, y ácido algínico), derivados de lignina, bentonita, polímeros solubles en agua sintéticos (p. ej., poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona, y poli(ácido acrílico), PAP (p. ej., fosfato ácido de isopropilo), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol), y BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol).

El método para el control de artrópodos nocivos de la presente invención se lleva a cabo usualmente aplicando el agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención directamente a los artrópodos nocivos, o aplicándolo a las plantas del hábitat, a los suelos y a los nidos de los artrópodos nocivos.

Para el método de control de artrópodos nocivos de la presente invención, el presente compuesto se puede utilizar tal cual. Usualmente, el método incluye un método que comprende formular el presente compuesto en el agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención como se ha descrito antes y aplicar el agente para el control de artrópodos nocivos a los artrópodos nocivos o un lugar en el que habitan los artrópodos nocivos, por ejemplo, mediante el mismo método de aplicación que un agente para el control de artrópodos nocivos convencional, poniendo de ese modo el agente para el control de artrópodos nocivos en contacto con los artrópodos nocivos anteriores o permitiendo que los artrópodos nocivos ingieran el agente para el control de artrópodos nocivos.

Los ejemplos del lugar donde habitan los artrópodos nocivos de la presente invención incluyen arrozales, tierras cultivadas, huertos, tierras no cultivadas y casas.

5 Los ejemplos del método de aplicación incluyen el tratamiento mediante pulverización, el tratamiento del suelo, el tratamiento de las semillas, y el tratamiento del medio de cultivo acuoso.

10 El tratamiento por pulverización de la presente invención es un método de tratamiento que comprende tratar las superficies de las plantas o los propios artrópodos nocivos con el ingrediente activo (el presente compuesto) para producir un efecto de control sobre los artrópodos nocivos. Los ejemplos específicos del tratamiento por pulverización incluyen el tratamiento por pulverización del follaje, y el tratamiento por pulverización de los troncos de los árboles.

15 El tratamiento del suelo es un método de tratamiento que comprende tratar el suelo o un líquido de irrigación con el ingrediente activo con el fin de permitir que el ingrediente activo penetre y se transfiera al interior del cuerpo de una planta del cultivo que se va a proteger del daño, por ejemplo ingestión, por los artrópodos nocivos, por ejemplo, a través de la parte de la raíz de la planta, protegiendo de ese modo el cultivo del daño por los artrópodos nocivos. Los ejemplos específicos del tratamiento del suelo incluyen el tratamiento del hoyo de plantación (pulverización en los hoyos de plantación, mezclado del suelo después del tratamiento del hoyo de plantación), el tratamiento del pie de la planta (pulverización en el pie de la planta, mezclado del suelo después del tratamiento del pie de la planta, irrigación del pie de la planta, tratamiento del pie de la planta en un estado de emergencia de la semilla más tardío), el tratamiento del surco de plantación (pulverización en el surco de plantación, mezclado del suelo después del tratamiento del surco de plantación), el tratamiento de la hilera de plantación (pulverización de la hilera de plantación, mezclado del suelo después del tratamiento de la hilera de plantación, pulverización de la hilera de plantación en una fase de desarrollo), el tratamiento de la hilera de plantación en el momento de la siembra (pulverización de la hilera de plantación en el momento de la siembra, mezclado del suelo después del tratamiento de la hilera de plantación en el momento de la siembra), el tratamiento por zonas (pulverización del total de la superficie del suelo, mezclado del suelo después del tratamiento por zonas), otro tratamiento del suelo por pulverización (pulverización de una formulación granular sobre las hojas en una fase de crecimiento, pulverización bajo el dosel o alrededor del tronco de un árbol, pulverización sobre la superficie del suelo, mezclado con el suelo superficial, pulverización en los hoyos para las semillas, pulverización sobre las superficies de los surcos, pulverización entre las plantas), otro tratamiento de irrigación (irrigación del suelo, irrigación en una fase de emergencia del plantón, tratamiento por inyección de la solución de fármaco, irrigación de una parte de la planta inmediatamente por encima de la tierra, irrigación por goteo con la solución de fármaco, quimigación), tratamiento de la caja de emergencia de plantones (pulverización en una caja de emergencia de plantones, irrigación de la caja de emergencia de plantones), tratamiento de la bandeja de emergencia de plantones (pulverización sobre la bandeja de emergencia de plantones, irrigación de la bandeja de emergencia de plantones), tratamiento del semillero (pulverización sobre un semillero, irrigación de un semillero, pulverización sobre un vivero de arroz de tierras bajas, inmersión de plantones), tratamiento de incorporación al suelo del semillero (mezclado con el suelo del semillero, mezclado con el suelo del semillero antes de la siembra), y otro tratamiento (mezclado con el suelo de cultivo, arado, mezclado con el suelo superficial, mezclado con el suelo en el lugar en el que las gotas de lluvia caen del dosel, tratamiento en una posición de la plantación, pulverización de una formulación en gránulos sobre agrupaciones de flores, mezclado con un fertilizante en pasta).

45 El tratamiento de las semillas es un método de tratamiento que comprende aplicar el ingrediente activo directamente en o alrededor de una semilla, un tubérculo o un bulbo de un cultivo que se va a proteger del daño, tal como la ingestión por los artrópodos nocivos para producir un efecto de control sobre los artrópodos nocivos. Los ejemplos específicos del tratamiento de las semillas incluyen tratamiento por pulverización, tratamiento por recubrimiento mediante pulverización, tratamiento por inmersión, tratamiento por impregnación, tratamiento por recubrimiento, tratamiento por recubrimiento con película, y tratamiento por recubrimiento con bolitas.

50 El tratamiento del medio de cultivo acuoso es un método de tratamiento que comprende tratar un medio de cultivo acuoso o similar con un ingrediente activo con el fin de permitir que el ingrediente activo penetre y se transfiera al interior del cuerpo de la planta de un cultivo que se va a proteger del daño, tal como la ingestión, por los artrópodos nocivos, por ejemplo, a través de la parte de la raíz de la planta, protegiendo de ese modo el cultivo del daño por los artrópodos nocivos. Los ejemplos específicos del tratamiento del medio de cultivo acuoso incluyen el mezclado con un medio de cultivo acuoso, y la incorporación al medio de cultivo acuoso.

60 Cuando el agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención se utiliza para el control de artrópodos nocivos en el campo de la agricultura, la cantidad de aplicación del mismo es usualmente de 1 a 10.000 g del presente compuesto por 10.000 m² en términos de la cantidad del presente compuesto. Cuando un agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención está en forma de una formulación tal como un producto concentrado emulsionable, un polvo mojable o una formulación en pasta líquida, el agente para el control de artrópodos nocivos se aplica usualmente después de haberlo diluido con agua de manera que la concentración de ingrediente activo alcance de 0,01 a 10.000 ppm. Cuando el agente para el control de artrópodos nocivos está en forma de una formulación tal como gránulos o polvo, el agente para el control de artrópodos nocivos se aplica usualmente tal cual.

Estos agentes para el control de artrópodos nocivos y la dilución en agua de los mismos se pueden pulverizar directamente a los artrópodos nocivos o a las plantas tales como los cultivos que se van a proteger de los artrópodos nocivos. Alternativamente, se puede tratar el suelo de un terreno cultivado con el agente para el control de artrópodos nocivos o una dilución en agua del mismo con el fin de controlar los artrópodos nocivos que habitan en el suelo.

El agente para el control de los artrópodos nocivos puede estar en forma de una preparación de resina que se procesa en una lámina o un cordón. Dicha preparación de resina se puede aplicar envolviendo un cultivo con una lámina o un cordón de la preparación de resina, poniendo un cordón de la preparación de resina alrededor de un cultivo de manera que el cultivo esté rodeado por el cordón, o colocando una lámina de la preparación de resina sobre la superficie del suelo cerca de la raíz del cultivo.

Cuando el agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención se utiliza para el control de artrópodos nocivos que viven en una casa (p. ej. mosca, mosquito, y cucaracha), la cantidad de aplicación del mismo es usualmente de 0,01 a 1.000 mg por 1 m² en términos de la cantidad del presente compuesto en el caso de un tratamiento de una superficie plana, y es usualmente de 0,01 a 500 mg por 1 m² en términos de la cantidad del presente compuesto en el caso de un tratamiento espacial. Cuando el agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención está en forma de una formulación tal como un producto concentrado emulsionable, un polvo mojable o una formulación en pasta líquida, el agente para el control de artrópodos nocivos se aplica usualmente una vez que se ha diluido con agua de manera que la concentración del ingrediente activo alcanza de 0,1 a 1.000 ppm. Cuando el agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención está en forma de una formulación tal como una solución oleosa, una formulación en aerosol, un fumigante o un cebo envenenado, el agente para el control de artrópodos nocivos se aplica usualmente tal cual.

El presente compuesto se puede utilizar en un agente para el control de artrópodos nocivos para terrenos de cultivo tales como terrenos cultivados, arrozales, césped y huertos, o terrenos no cultivados.

El agente para el control de artrópodos nocivos de la presente invención puede contener adicionalmente, por ejemplo, otros agentes para el control de artrópodos nocivos, acaricidas, nematocidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, sinergistas, fertilizantes, acondicionadores del suelo, y alimentos para animales.

También es posible utilizar el presente compuesto para el tratamiento por pulverización, el tratamiento del suelo, el tratamiento de las semillas, y el tratamiento del medio de cultivo acuoso como una formulación mixta preparada apropiadamente mezclando el presente compuesto con agentes para el control de organismos nocivos tales como insecticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, agentes con hormonas vegetales, reguladores del crecimiento de las plantas y herbicidas (incluyendo isómeros y sales de los mismos), o, por ejemplo, sinergistas, agentes reductores de la fitotoxicidad, colorantes, y fertilizantes.

Los ejemplos del ingrediente activo de los otros agentes para el control de artrópodos nocivos, acaricidas y/o nematocidas anteriores incluyen los siguientes:

(1) Compuestos organofosforados acefato, Fosfuro de aluminio, butatofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos : CYAP, diazinon, DCIP (éter diclorodisopropílico), diclofention : ECP, diclorvos : DDVP, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, fentión : MPP, fenitrotión : MEP, fostiazato, formotión, Fosfuro de hidrógeno, isofenfos, isoxatión, malatión, mesulfenfos, metidatión : DMTP, monocrotofos, naled : BRP, oxideprofos : ESP, paratión, fosalona, fosmet : PMP, pirimifos-metilo, piridafentión, quinalfos, fentoato:PAP, profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitión, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometón, triclorfón: DEP, y vamidotión;

(2) Compuestos de carbamato alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC carbarilo, carbofurán, carbosulfán, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb:MIPC, metolcarb, metomilo, metiocarb, NAC, oxamilo, pirimicarb, propoxur : PHC, XMC, tiodicarb, y xililcarb;

(3) Compuestos piretroides sintéticos acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigmacipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanecarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, (EZ)-(1RS,3RS:1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanecarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbencilo, y (1RS,3RS:1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanecarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo;

(4) Compuestos de nereistoxina cartap, bensultap, tiociclam, monosultap, y bisultap;

(5) Compuestos neonicotinoides imidacloprida, nitenpiram, acetamiprida, tiametoxam, tiacloprida, dinotefurán, y clotianidina;

(6) Compuestos de benzoilurea clorfluazurón, bistriflurón, diafentiurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, y triflumurón;

(7) Compuestos de fenilpirazol acetoprol, etiprol, fipronil, vaniliprol, piriiprol, y pirafuprol;

(B) Esporas viables como insecticidas con toxina Bt de *Bacillus thuringiensis* y toxinas cristalinas producidas a partir de las mismas, y una mezcla de los mismos;

(9) Compuestos de hidrazina cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, y tebufenozida;

(10) Compuestos organoclorados aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfán, y metoxiclor;

(11) Insecticidas naturales aceite de maquinaria, y sulfato de nicotina;

(12) Otros insecticidas avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciromazina, D-D(1,3-Dicloropropeno), emamectina-benzoato, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, indoxacarb, metoxadiazona, A(milbemicina-A), pimetrozina, piridililo, piriproxifeno, espinosad, sulfluramida, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, SI-0009, ciflumetofeno, Ácido arsénico, benclotiaz, Cianamida de calcio, Polisulfuro de calcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamida, flurimfeno, formetanato, metam-amonio, metam-sodio, Bromuro de metilo, nidinotefurán, Oleato de potasio, protrifenbute, espiromesifeno, Azufre, metaflumizona, y espirotetramat;

Acaricidas acequinocilo, amitraz, benzoximato, bromopropilato, quinometionato, clorobenzilato, CPCBS (clorfenson), clofentezina, dicofol, etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacripirim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita:BPPS, polinactinas, piridabeno, Pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifón, espiroclifofeno, amidoflumet, Bifenazato, y Ciflumetofeno;

Nematocidas (ingredientes activos nematocidas) DCIP, fostiazato, levamisol, metilisotiocianato, y tartrato de morantel.

20 Ejemplos

Más adelante, la presente invención se explicará con más detalle por medio de Ejemplos de Producción, Ejemplos de Formulación, y Ejemplos de Ensayo, pero la presente invención no está limitada a estos Ejemplos.

En primer lugar, se explicarán los Ejemplos de Producción del presente compuesto.

25

Ejemplo de Producción 1

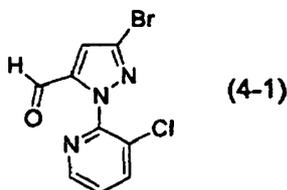
(1) Una mezcla de 10,7 g de 3-bromo-1H-pirazol, 11,8 g de 2,3-dicloropiridina, 57,3 g de carbonato de cesio y 80 mL de N,N-dimetilformamida se agitó a 100°C durante 8 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo dos veces con metil terc-butil éter. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de magnesio, y se concentraron a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 12,9 g de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina. 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 6,51 (1H, d, J = 2 Hz), 7,31 (1H, dd, J = 8 Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8,04 (1H, d, J = 2 Hz), 8,45 (1H, dd, J = 4 Hz, 1 Hz)

(2) A una mezcla de 5,0 g de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina y 30 mL de tetrahidrofurano, se le añadieron gota a gota 11,7 mL de una solución en heptano/tetrahidrofurano/etilbenceno de diisopropilamido de litio 2,0 M a -78°C. A la mezcla de reacción, se le añadieron gota a gota una mezcla de 3 g de formiato de etilo y 10 mL de tetrahidrofurano a -78°C, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 3,0 g del compuesto (4-1).

Compuesto (4-1)

45

[Fórmula Química 119]

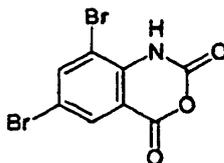


RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 7,11 (1H, s), 7,47 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,96 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8,52 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9,79 (1H, s)

50

(3) A una mezcla de 0,61 g de oxalato de etilhidrazina, 1,0 g de 6,8-dibromo-2H-3,1-benzoxazino-2,4-1H-diona

[Fórmula Química 120]



5 (un compuesto descrito en Journal of Organic Chemistry (1947), 12, 743-51) y 10 mL de tetrahidrofurano, se le añadieron 1,12 g de carbonato de potasio enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 1,5 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,44 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etilhidrazina y 0,13 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-etilhidrazina.

N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etilhidrazina

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,25 (3H, t, J = 7 Hz), 3,52 (2H, c, J = 7 Hz), 4,38 (2H, s ancho), 4,81 (2H, s ancho), 7,21 (1H, d, J = 2 Hz), 7,59 (1H, d, J = 2 Hz)

15 N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-etilhidrazina RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,15 (3H, t, J = 7 Hz), 2,95 (2H, c, J = 7 Hz), 4,78 (1H, s ancho), 6,02 (2H, s ancho), 7,38 (1H, d, J = 2 Hz), 7,52 (1H, s ancho), 7,64 (1H, d, J = 2 Hz)

(4) A una mezcla de 0,42 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etilhidrazina y 3 mL de piridina, se le añadieron 0,15 g de cloroforniato de metilo enfriando con hielo, seguido de agitación enfriando con hielo durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo resultante, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,42 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etil-N'-metoxicarbonilhidrazina.

25 N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etil-N'-metoxicarbonilhidrazina

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,21 (3H, t, J = 7 Hz), 3,62 (2H, c, J = 7 Hz), 3,78 (3H, s), 4,95 (2H, s ancho), 6,96 (1H, s ancho), 7,26 (1H, d, J = 2 Hz), 7,59 (1H, d, J = 2 Hz)

(5) Una mezcla de 0,15 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etil-N'-metoxicarbonilhidrazina, 2 mL de N,N-dimetilformamida, 0,050 g de bromoacetnitrilo y 0,079 g de carbonato de potasio se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con metil terc-butil éter. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,15 g del compuesto (6-1). El compuesto (6-1)

35 [Fórmula Química 121]



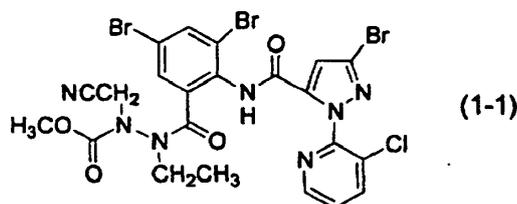
(6-1)

RMN H^1 ($DMSO-d_6$, 80°C, TMS) δ (ppm): 1,16 (3H, t, J = 7 Hz), 3,45-3,55 (2H, m), 3,77 (3H, s), 4,62-4,73 (2H, m), 5,26 (2H, s ancho), 7,26 (1H, d, J = 2 Hz), 7,66 (1H, d, J = 2 Hz)

40 (6) Una mezcla de 0,14 g del anterior compuesto (6-1), 0,092 g del anterior compuesto (4-1), 0,095 g de o-cloranilo, monohidrato de ácido p-toluenosulfónico (cantidad catalítica), yoduro de cobre (cantidad catalítica) y 1,5 mL de 1,4-dioxano se agitó en una atmósfera de nitrógeno en condiciones de calentamiento a reflujo durante 6 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó sucesivamente con una solución acuosa de hidróxido de sodio 2 N, agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,19 g del siguiente presente compuesto (1-1).

Presente compuesto (1-1)

[Fórmula Química 122]



RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,08-1,14 (3,0H, m), 3,22 (1,1H, s), 3,33-3,52 (1,5H, m), 3,60-4,13 (3,8H, m), 4,68-4,84 (0,6H, m), 7,15-7,25 (1,0H, m), 7,30-7,31 (0,6H, m), 7,42-7,50 (1,4H, m), 7,64-7,70 (1,0H, m), 7,91-7,94 (1,0H, m), 8,48-8,57 (1,0H, m), 9,26-9,35 (1,0H, m)

Ejemplo de Producción 2

(1) En lugar de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etilhidrazina del Ejemplo de Producción 1 (4), se utiliza N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-etilhidrazina (un compuesto obtenido en el Ejemplo de Producción 1 (3)) para obtener N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-etil-N'-metoxycarbonilhidrazina.

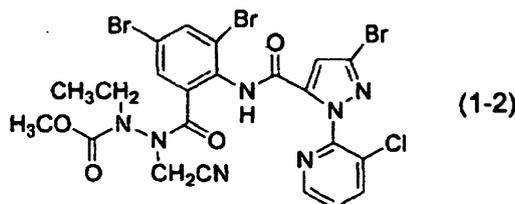
(2) En lugar de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-etil-N'-metoxycarbonilhidrazina del Ejemplo de Producción 1 (5), se utiliza N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-etil-N'-metoxycarbonilhidrazina para obtener el compuesto (6-2).

[Fórmula Química 123]



(3) En lugar del compuesto (6-1) del Ejemplo de Producción 1 (6), se utiliza el compuesto (6-2) para obtener el siguiente presente compuesto (1-2).
Presente compuesto (1-2)

[Fórmula Química 124]



Ejemplo de Producción 3

(1) A una mezcla de 10,0 g de 6,8-dibromo-2H-3,1-benzoxazino-2,4-1H-diona y 90 mL de tetrahidrofurano, se añadieron 1,58 g de metilhidrazina enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 4,64 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-metilhidrazina y 0,75 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-metilhidrazina.

N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-metilhidrazina

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 4,55 (2H, s ancho), 4,89 (2H, s ancho), 7,23 (1H, s), 7,59 (1H, s)

N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-metilhidrazina

RMN H^1 ($DMSO-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,51 (3H, s), 5,11 (1H, s ancho), 6,54 (2H, s), 7,63 (1H, d, J = 2 Hz), 7,73 (1H, d, J = 2 Hz), 10,06 (1H, s ancho)

(2) A una mezcla de 3,40 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N-metilhidrazina y 30 mL de tetrahidrofurano, se le añadieron sucesivamente 2,2 g de trietilamina y 2,0 g cloroforniato de metilo enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y

se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 1,10 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N-metil-N'-metoxycarbonilhidrazina.

N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N-metil-N'-metoxycarbonilhidrazina

5 RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,28 (3H, s), 3,76 (3H, s), 4,96 (2H, s ancho), 7,00 (1H, s ancho), 7,27 (1H, d, J = 2 Hz), 7,59 (1H, d, J = 2 Hz)

(3) En lugar de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N-etil-N'-metoxycarbonilhidrazina del Ejemplo de Producción 1 (5), se utiliza N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N-metil-N'-metoxycarbonilhidrazina para obtener el compuesto (6-3).
Compuesto (6-3)

10

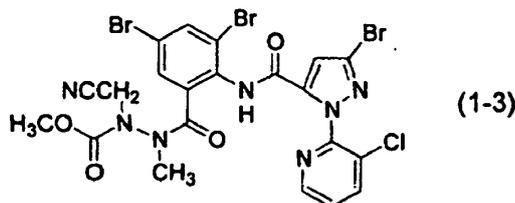
[Fórmula Química 125]



15

(4) En lugar del compuesto (6-1) del Ejemplo de Producción 1 (6), se utiliza el compuesto (6-3) para obtener el siguiente presente compuesto(1-3).
Presente compuesto (1-3)

[Fórmula Química 126]

**Ejemplo de Producción 4**

5 (1) A una mezcla de 0,33 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-metilhidrazina (un compuesto obtenido en el Ejemplo de Producción 3 (1)) y 3 mL de piridina, se le añadieron 0,097 g de cloroformiato de metilo enfriando con hielo, seguido de agitación enfriando con hielo durante 1 hora. A la mezcla de reacción, se le añadieron
10 adicionalmente 0,032 g de cloroformiato de metilo enfriando con hielo, seguido de agitación enfriando con hielo durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo resultante, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,31 g de N-(2-amino-3,5-

15 N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-metil-N'-metoxicarbonilhidrazina.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,26 (3,0H, s), 3,78 (3,0H, s ancho), 6,06 (2,0H, s ancho), 7,51 (1,0H, s ancho), 7,65 (1,0H, s ancho), 7,83 (0,5H, s ancho), 8,25 (0,5H, s ancho)

(2) En lugar de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-etil-N'-metoxicarbonilhidrazina del Ejemplo de Producción 1 (5), se utiliza N-(2-amino-3,5-dibromobenzoyl)-N'-metil-N'-metoxicarbonilhidrazina para obtener el compuesto (6-4).

20 Compuesto (6-4)

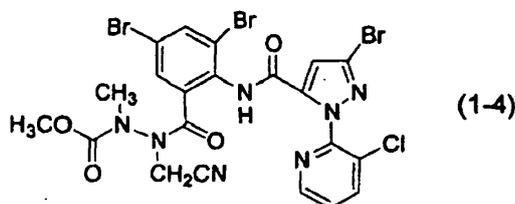
[Fórmula Química 127]



25 (3) En lugar del compuesto (6-1) del Ejemplo de Producción 1 (6), se utiliza el compuesto (6-4) para obtener el siguiente presente compuesto(1-4).

Presente compuesto (1-4)

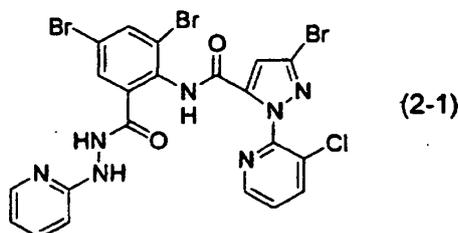
[Fórmula Química 128]

**Ejemplo de Producción 5**

30 (1) Una mezcla de 2,0 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,58 g de 2-hidrazinopiridina, 0,74 g de carbonato de potasio y 50 mL de tetrahidrofurano se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El sólido resultante se lavó con cloroformo para obtener 1,86 g del compuesto (2-1).

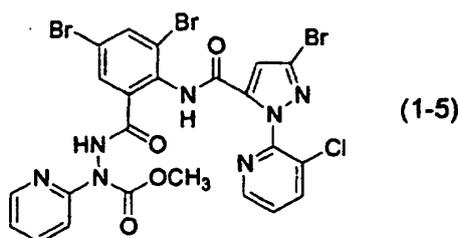
35 Compuesto (2-1)

[Fórmula Química 129]



- 5 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ : 6,59 (1H, d, J = 8 Hz), 6,70 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,38 (1H, s), 7,41-7,46 (1H, m), 7,61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,78 (1H, d, J = 2 Hz), 8,01-8,04 (1H, m), 8,15-8,18 (2H, m), 8,30 (1H, s), 8,52 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 10,27 (1H, s ancho), 10,54 (1H, s ancho)
- 10 (2) A una mezcla de 0,50 g del compuesto (2-1) y 5 mL de piridina, se le añadieron gota a gota 115 μ L de cloroformiato de metilo enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de añadir agua, la reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,40 g del presente compuesto (1-5).
- 15 Presente compuesto (1-5)

[Fórmula Química 130]

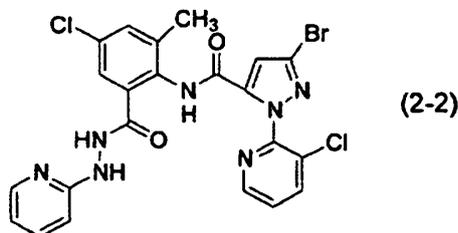


- 20 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ : 3,62 (3H, s), 7,18 (1H, dd, J = 7 Hz, 5 Hz), 7,31 (1H, s), 7,61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,67 (1H, d, J = 8 Hz), 7,76-7,82 (2H, m), 8,16 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8,20 (1H, d, J = 2 Hz), 8,28 (1H, d, J = 7 Hz), 8,50 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 10,48 (1H, s), 11,13 (1H, s)

Ejemplo de Producción 6

- 25 (1) En lugar de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona del Ejemplo de Producción 5(1), se utilizó 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obtener el compuesto (2-2).
- 30 Compuesto (2-2)

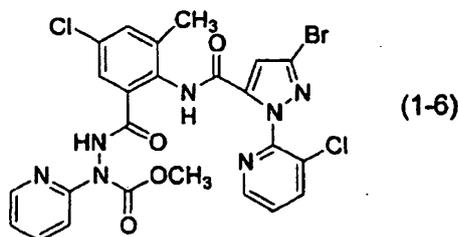
[Fórmula Química 131]



- 35 RMN H^1 (DMS O- D_6) δ : 2,18 (3H, s), 6,60 (1H, d, J = 9 Hz), 6,69 (1H, dd, J = 7 Hz, 5 Hz), 7,29 (1H, s), 7,41-7,45 (1H, m), 7,49 (1H, d, J = 2 Hz), 7,55 (1H, d, J = 2 Hz), 7,61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8,02-8,04 (1H, m), 8,18 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,28 (1H, s), 8,51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 10,20 (1H, s), 10,28 (1H, s)

- (2) En lugar del compuesto (2-1) del Ejemplo de Producción 5 (2), se utilizó el compuesto (2-2) para obtener el presente compuesto (1-6).
- 40 Presente compuesto (1-6)

[Fórmula Química 132]

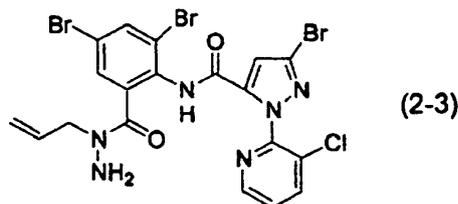


5 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ : 2,18 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,17 (1H, ddd, J = 7 Hz, 5 Hz, 1 Hz), 7,21 (1H, s), 7,48 (1H, d, J = 2 Hz), 7,58-7,63 (2H, m), 7,69 (1H, d, J = 8 Hz), 7,78-7,82 (1H, m), 8,17 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,27-8,29 (1H, m), 8,50 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 10,20 (1H, s ancho), 11,06 (1H, s ancho).

Ejemplo de Producción 7

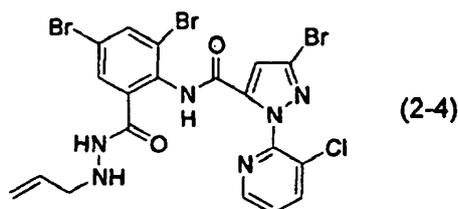
10 (1) Una mezcla de 1,0 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,37 g de una solución acuosa de alilhidrazina al 70% y 25 mL de tetrahidrofurano se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,82 g de una mezcla del compuesto (2-3) y el compuesto (2-4).
15 Compuesto (2-3)

[Fórmula Química 133]



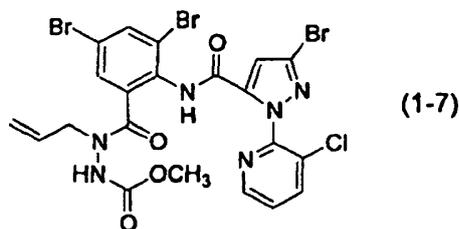
20 Compuesto (2-4)

[Fórmula Química 134]



25 (2) A una mezcla de 0,82 g de la mezcla del compuesto (2-3) y el compuesto (2-4), y 8 mL de piridina, se le añadieron gota a gota 400 μ L de clorofornio de metilo enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,53 g del presente compuesto (1-7) y 0,23 g del presente compuesto (1-8).
30 Presente compuesto (1-7)

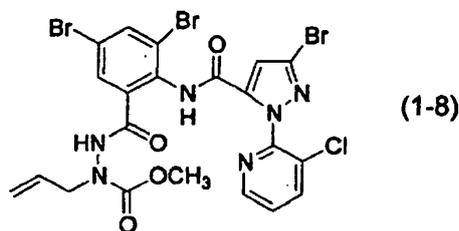
[Fórmula Química 135]



(1-7)

5 RMN H¹ (DMSO-D₆) δ: 3,49 (3,0H, s), 3,61-3,82 (1,5H, m), 4,34-4,48 (0,5H, m), 5,03-5,26 (2,0H, m), 5,53-5,73 (1,0H, m), 7,35-7,44 (2,0H, m), 7,61-7,65 (1,0H, m), 8,08-8,13 (1,0H, m), 8,17-8,21 (1,0H, m), 8,51 (1,0H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9,05 (0,7H, s), 9,70 (0,3H, s), 10,25 (0,7H, s), 10,68 (0,3H, s)
Presente compuesto (1-8)

[Fórmula Química 136]



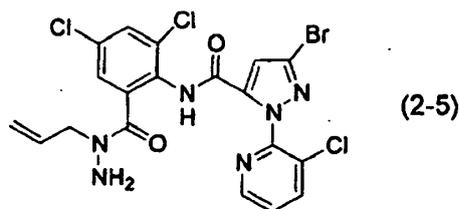
(1-8)

10 RMN H¹ (DMSO-D₆) δ: 3,52 (3H, s ancho), 3,87 (2H, s ancho), 5,00-5,08 (2H, m), 5,64-5,74 (1H, m), 7,45 (1H, s), 7,58-7,62 (2H, m), 8,13-8,19 (2H, m), 8,48 (1H, d, J = 5 Hz), 10,50 (1H, s), 10,62 (1H, s)

15 Ejemplo de Producción 8

(1) En lugar de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona del Ejemplo de Producción 7 (1), se utilizó 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obtener una mezcla del compuesto (2-5) y el compuesto (2-6).
20 Compuesto (2-5)

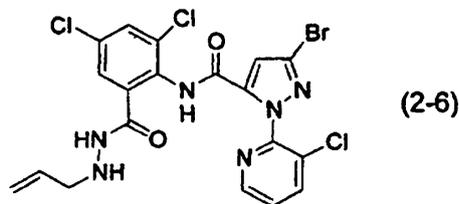
[Fórmula Química 137]



(2-5)

Compuesto (2-6)

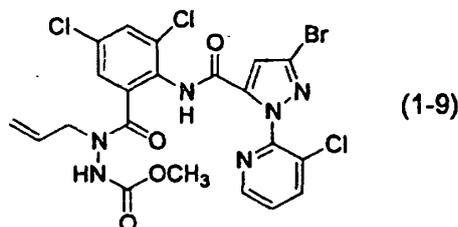
[Fórmula Química 138]



(2-6)

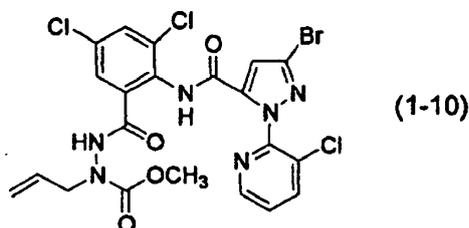
25 (2) En lugar de la mezcla del compuesto (2-3) y el compuesto (2-4) del Ejemplo de Producción 7 (2), se utilizaron el compuesto (2-5) y el compuesto (2-6) para obtener el presente compuesto (1-9) y el presente compuesto (1-10).
30 El presente compuesto (1-9)

[Fórmula Química 139]



5 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ : 3,48 (3,0H, s), 3,63-4,43 (2,0H, m ancho), 5,04-5,27 (2,0H, m), 5,58-5,73 (1,0H, m), 7,26-7,44 (2,0H, m), 7,62-7,65 (1,0H, m), 7,85-7,91 (1,0H, m), 8,20 (1,0H, d, J = 8 Hz), 8,50 (1,0H, d, J = 5 Hz), 9,17 (0,7H, s), 9,72 (0,3H, s), 10,24 (0,7H, s), 10,69 (0,3H, s)
Presente compuesto (1-10)

[Fórmula Química 140]



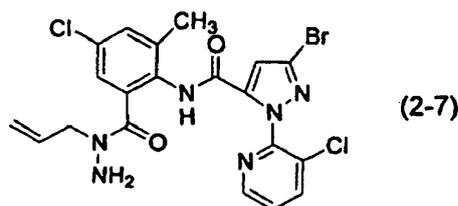
10 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ : 3,53 (3H, s ancho), 3,89 (2H, s ancho); 5,00-5,08 (2H, m), 5,65-5,75 (1H, m), 7,44 (2H, s ancho), 7,60 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,96 (1H, d, J = 2 Hz), 8,16 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8,48 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 10,53 (1H, s), 10,65 (1H, s)

15 Ejemplo de Producción 9

(1) Una mezcla de 1,5 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,68 g de una solución acuosa de alihidrazina al 70% y 40 mL de tetrahidrofurano se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,75 g del compuesto (2-7) y 0,37 g del compuesto (2-8).

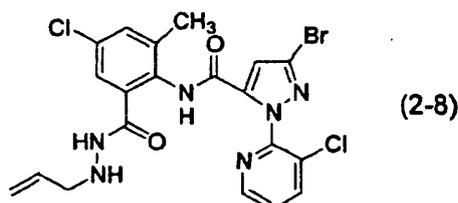
25 Compuesto (2-7)

[Fórmula Química 141]



30 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ : 2,15 (3,0H, s), 3,59-3,62 (0,6H, m), 4,06-4,09 (1,4H, m), 4,41 (1,4H, s), 4,81 (0,6H, s), 5,02-5,23 (2,0H, m), 5,62-5,75 (1,0H, m), 7,15 (0,3H, d, J = 2 Hz), 7,21 (0,7H, d, J = 2 Hz), 7,33 (0,7H, s), 7,36-7,37 (1,0H, m), 7,47 (0,3H, d, J = 2 Hz), 7,61-7,65 (1,0H, m), 8,17-8,21 (1,0H, m), 8,49-8,52 (1,0H, m), 10,12 (0,7H, s), 10,39 (0,3H, s)
Compuesto (2-8)

[Fórmula Química 142]

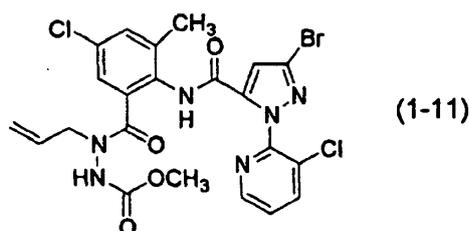


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 2,16 (3H, s), 3,37-3,40 (2H, m), 5,02-5,15 (3H, m), 5,76-5,86 (1H, m), 7,28 (1H, d, $J = 2$ Hz), 7,38 (1H, s), 7,49 (1H, d, $J = 2$ Hz), 7,60 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,16 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,48 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,76-9,78 (1H, m), 10,22 (1H, s)

(2) A una mezcla de 0,65 g del compuesto (2-7) y 23 mL de piridina, se le añadieron 0,14 g de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,04 g del presente compuesto (1-11).

Presente compuesto (1-11)

[Fórmula Química 143]



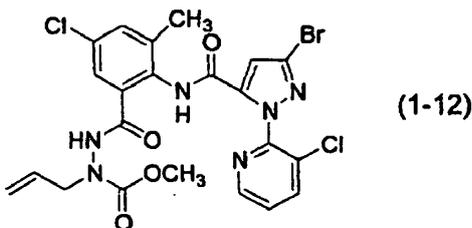
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,04 (3H, s), 3,57 (3H, s), 3,74-4,20 (2H, m ancho), 5,19-5,29 (2H, m), 5,62-5,70 (1H, m), 7,03 (1H, s), 7,07 (1H, s), 7,21 (1H, s), 7,38 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,52 (1H, s), 7,86 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 1 Hz), 8,45 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 1 Hz), 9,73 (1H, s ancho)

Ejemplo de Producción 10

A una mezcla de 0,26 g del compuesto (2-8) y 9 mL de piridina, se le añadieron 0,35 g de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,15 g del presente compuesto (1-12).

Presente compuesto (1-12)

[Fórmula Química 144]



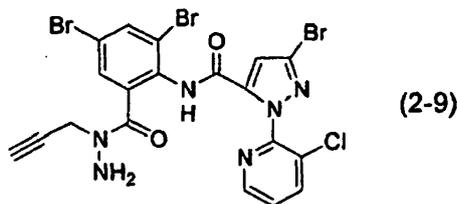
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,20 (3H, s), 3,74 (3H, s ancho), 4,16-4,19, (2H, m), 5,15-5,21 (2H, m), 5,77-5,87 (1H, m), 7,04 (1H, s), 7,29-7,39 (3H, m), 7,85-7,91 (2H, m), 8,43 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,46 (1H, s)

Ejemplo de Producción 11

(1) Una mezcla de 0,41 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,21 g de dihidrocloruro de propargilhidrazina (un compuesto descrito en Sinlett (2004), 2355-2356), 1,02 g de carbonato de potasio y 7 mL de N,N-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con metil terc-butil éter. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,12 g de una mezcla del compuesto (2-9) y el compuesto (2-10).

Compuesto (2-9)

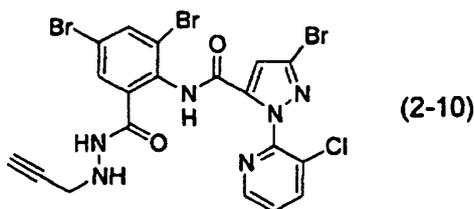
[Fórmula Química 145]



Compuesto (2-10)

5

[Fórmula Química 146]

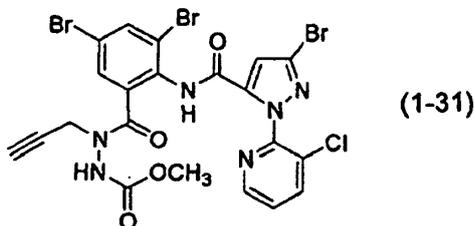


(2) A una mezcla de 0,12 g de la anterior mezcla del compuesto (2-9) y el compuesto (2-10) y 2 mL de piridina, se le añadieron 60 μ L de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 40 minutos. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,022 g del presente compuesto (1-31) y 0,088 g del presente compuesto (1-32).
El presente compuesto (1-31)

10

15

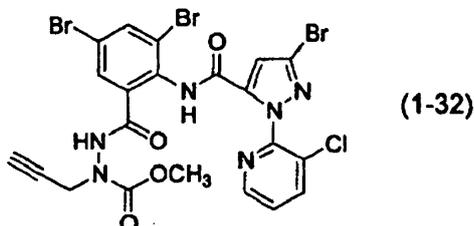
[Fórmula Química 147]



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,25 (1H, s), 3,62-3,86 (3H, m), 4,02-4,47 (2H, m ancho), 7,20 (1H, s), 7,38-7,47 (2H, m), 7,62-7,66 (2H, m), 7,87 (1H, d, J = 8 Hz), 8,48 (1H, d, J = 5 Hz), 9,33 (1H, s)
Presente compuesto (1-32)

20

[Fórmula Química 148]



25

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,22 (1H, s), 3,69 (3H, s ancho), 4,31 (2H, s), 7,10-7,16 (1H, m), 7,35-7,40 (1H, m), 7,64 (1H, s ancho), 7,80-7,88 (2H, m), 8,15 (1H, s ancho), 8,45 (1H, d, J = 5 Hz), 9,00 (1H, s ancho)

Ejemplo de Producción 12

30

35

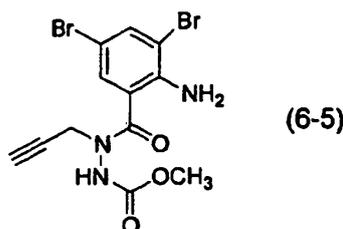
(1) A una mezcla de 1,85 g de carbazato de metilo y 60 mL de tetrahidrofurano, se le añadieron 6,0 g de 6,8-dibromo-2H-3,1-benzoxazino-2,4-1H-diona enfriando con hielo, seguido de agitación enfriando con hielo durante 3 horas. Después de calentar a temperatura ambiente, se añadieron adicionalmente 0,46 g de carbazato de metilo a la mezcla de reacción, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 15 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió agua al residuo resultante, y a continuación el sólido restante se recogió mediante filtración. El sólido se lavó sucesivamente con agua y acetato de etilo para obtener 4,96 g de N-(2-amino-

3,5-dibromobenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina. N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina RMN H^1 (DMSO- d_6) δ : 3,63 (3H, s), 6,55 (2H, s), 7,71 (1H, s), 7,79 (1H, s), 9,25 (1H, s), 10,32 (1H, s)

(2) A una mezcla de 2,0 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina, 0,90 g de carbonato de potasio y 25 mL de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 0,58 g de bromuro de propargilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2 horas y agitación adicional a 50°C durante 4 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,72 g del compuesto (6-5).

10 Compuesto (6-5)

[Fórmula Química 149]



15 RMN H^1 ($CDCl_3$) δ : 2,35 (1H, t, J = 3 Hz), 3,76 (3H, s), 4,44 (2H, s ancho), 4,98 (2H, s ancho), 7:06 (1H, s ancho), 7,34 (1H, d, J = 2 Hz), 7,61 (1H, d, J = 2 Hz)

(3) Una mezcla de 0,31 g de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxílico, 0,32 g de dicloruro de oxalilo, una gota de N,N-dimetilformamida y 5 mL de tolueno se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para preparar un cloruro de ácido.

20 A continuación, una mezcla del cloruro de ácido, 0,35 g del compuesto (6-5), 5 gotas de piridina y 5 gotas de xileno se agitó a 100°C durante 1 hora. Después de enfriar a temperatura ambiente y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,43 g del presente compuesto (1-31).

25

Ejemplo de Producción 13

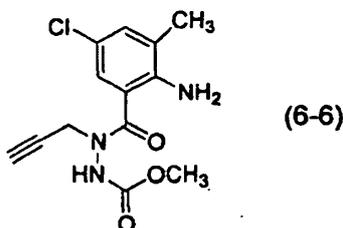
(1) En lugar de 6,8-dibromo-2H-3,1-benzoxazino-2,4-1H-diona del Ejemplo de Producción 12 (1), se utilizó 6-cloro-8-metil-2H-3,1-benzoxazino-2,4-1H-diona para obtener N-(2-amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina.

30 N-(2-amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina.
RMN H^1 ($CDCl_3$) δ : 2,13 (3H, s), 3,79 (3H, s), 5,50 (2H, s), 6,81 (1H, s ancho), 7,13 (1H, d, J = 2 Hz), 7,30 (1H, d, J = 2 Hz), 7,88 (1H, s ancho)

(2) En lugar de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina del Ejemplo de Producción 12 (2), se utilizó N-(2-amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina para obtener el compuesto (6-6).

35 Compuesto (6-6)

[Fórmula Química 150]

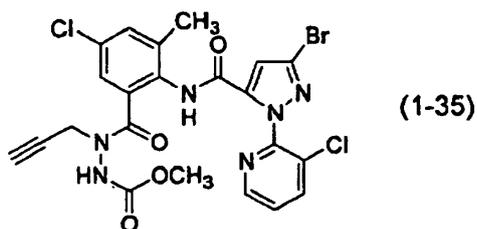


40 RMN H^1 ($CDCl_3$) δ : 2,13 (3H, s), 2,33 (1H, t, J = 3 Hz), 3,74 (3H, s), 4,44 (4H, s ancho), 7,08-7,13 (3H, m)

(3) En lugar del compuesto (6-5) del Ejemplo de Producción 12 (3), se utilizó el compuesto (6-6) para obtener el presente compuesto (1-35).

Presente compuesto (1-35)

[Fórmula Química 151]



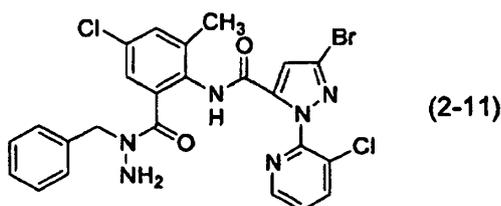
5 RMN H^1 ($CDCl_3$) δ : 2,08 (3H, s), 2,23 (1H, s), 3,60-3,77 (3H, m), 3,98-4,62 (2H, m), 7,08 (2H, s ancho), 7,18 (1H, s), 7,37 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, s), 7,85 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8,46 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9,55 (1H, s ancho)

Ejemplo de Producción 14

10 (1) Una mezcla de 0,50 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,45 g de dihidrocloruro de benzilhidrazina, 1,21 g de carbonato de potasio y 10 mL de N,N-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,31 g de una mezcla del compuesto (2-11) y el compuesto (2-12).

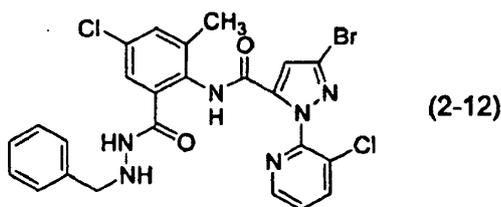
15 Compuesto (2-11)

[Fórmula Química 152]



20 Compuesto (2-12)

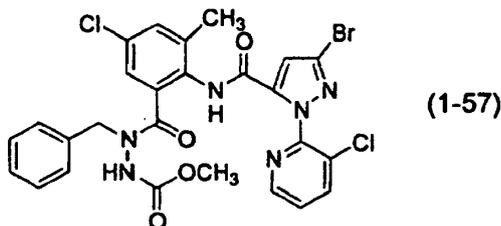
[Fórmula Química 153]



25 (2) A una mezcla de 0,31 g de la anterior mezcla del compuesto (2-11) y el compuesto (2-12) y 4 mL de piridina, se le añadieron 260 μ L de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 18 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,090 g del presente compuesto (1-57) y 0,057 g del presente compuesto (1-58).

30 Presente compuesto (1-57)

[Fórmula Química 154]

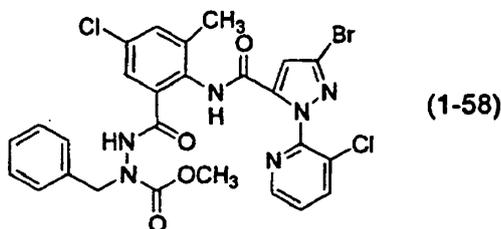


RMN ^1H (DMSO- D_6 , 100°C) δ : 2,13 (3H, s), 3,48 (3H, s), 4,65 (2H, s ancho), 7,03-7,10 (2H, m), 7,23-7,26 (5H, m), 7,37 (1H, s ancho), 7,57 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8,10 (1H, d, J = 8 Hz), 8,45 (1H, d, J = 5 Hz), 8,85 (1H, s ancho), 9,62 (1H, s ancho)

Presente compuesto (1-58)

5

[Fórmula Química 155]



RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 2,22 (3H, s), 3,55-3,68 (3H, m), 4,43 (2H, s ancho), 7,17-7,27 (6H, m), 7,37 (1H, s), 7,48-7,53 (1H, m), 7,56 (1H, d, J = 2 Hz), 8,06 (1H, d, J = 7 Hz), 8,40 (1H, d, J = 5 Hz), 10,24 (1H, s), 10,58 (1H, s)

10

Ejemplo de Producción 15

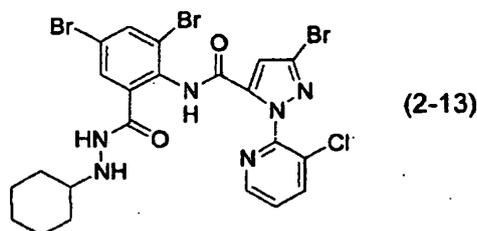
(1) Una mezcla de 0,61 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,33 g de hidrocloreto de ciclohexilhidrazina, 0,60 g de carbonato de potasio y 10 mL de N,N-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con metil terc-butil éter. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,39 g del compuesto (2-13).

15

Compuesto (2-13)

20

[Fórmula Química 156]



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 1,17-1,19 (4H, m), 1,55-1,85 (6H, m), 2,73-2,79 (1H, m), 4,60 (1H, s ancho), 7,29 (1H, s), 7,34 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,38 (1H, d, J = 2 Hz), 7,65 (1H, d, J = 2 Hz), 7,77 (1H, s ancho), 7,84 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,45 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,57 (1H, s)

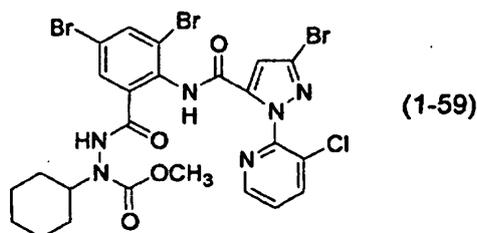
25

(2) A una mezcla de 0,25 g del compuesto (2-13) y 3 mL de piridina, se le añadieron 290 μL de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 20 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,23 g del presente compuesto (1-59).

30

Presente compuesto (1-59)

[Fórmula Química 157]



35

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 0,87-1,80 (10H, m), 3,65 (3H, s ancho), 4,01 (1H, s ancho), 7,22 (1H, s), 7,35 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,52 (1H, s ancho), 7,75 (1H, d, J = 2 Hz), 7,81-7,87 (2H, m), 8,41 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,42 (1H, s)

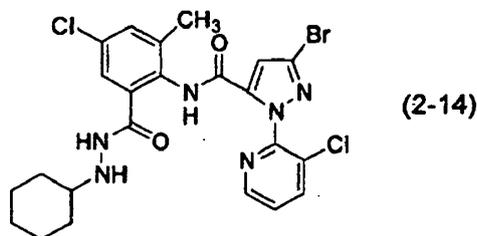
40

Ejemplo de Producción 16

(1) En lugar de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona del Ejemplo de Producción 15 (1), se utilizó 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obtener el compuesto (2-14).
Compuesto (2-14)

5

[Fórmula Química 158]



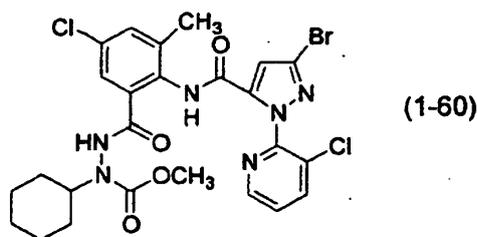
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 1,13-1,28 (4H, m), 1,60-1,86 (6H, m), 2,15 (3H, s), 2,75-2,80 (1H, m), 4,66 (1H, s ancho), 7,11 (1H, s), 7,16 (1H, d, $J = 2$ Hz), 7,23 (1H, d, $J = 2$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,66 (1H, s), 7,84 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 1 Hz), 8,46 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 1 Hz), 9,92 (1H, s)

10

(2) En lugar del compuesto (2-13) del Ejemplo de Producción 15 (2), se utilizó el compuesto (2-14) para obtener el presente compuesto (1-60).
Presente compuesto (1-60)

15

[Fórmula Química 159]



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 0,87-1,88 (10H, m), 2,20 (3H, s), 3,69 (3H, s ancho), 4,07 (1H, s ancho), 7,05 (1H, s), 7,30-7,33 (2H, m), 7,37 (1H, dd, $J = 8, 5$ Hz), 7,53 (1H, s), 7,85 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,43 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,48 (1H, s)

20

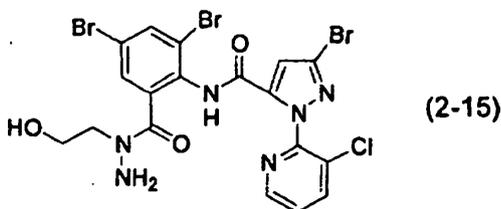
Ejemplo de Producción 17

(1) Una mezcla de 0,60 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,41 g de 2-hidroxietilhidrazina y 20 mL de N,N-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante 0,5 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con metil terc-butil éter. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,21 g del compuesto (2-15).

25

30 Compuesto (2-15)

[Fórmula Química 160]



RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 3,40-3,57 (4,0H, m), 4,51 (1,3H, s), 4,73 (0,7H, t, $J = 5$ Hz), 4,81 (0,7H, s), 5,00 (0,3H, s ancho), 7,35 (0,3H, s), 7,41 (0,7H, s), 7,54 (0,6H, d, $J = 2$ Hz), 7,61-7,64 (1,4H, m), 7,95 (0,7H, d, $J = 2$ Hz), 8,03 (0,3H, d, $J = 2$ Hz), 8,16-8,20 (1,0H, m), 8,49-8,52 (1,0H, m), 10,37 (0,7H, s), 10,55 (0,3H, s)

35

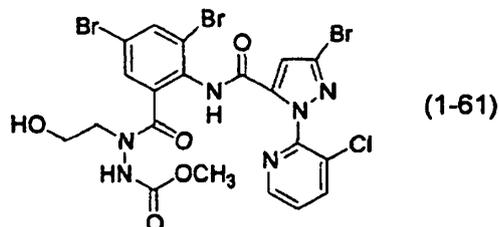
40

(2) A una mezcla de 0,21 g del compuesto (2-15) y 3 mL de piridina, se le añadieron 40 μL de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación enfriando con hielo durante 1 hora. A la mezcla de reacción, se le añadieron gota a gota 25 μL de cloroformiato de metilo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 1,5 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo

resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,12 g del presente compuesto (1-61).

Presente compuesto (1-61)

[Fórmula Química 161]



RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 3,26-3,56 (7,0H, m), 4,72 (1,0H, s), 7,39-7,49 (2,0H, m), 7,60-7,65 (1,0H, m), 8,04-8,09 (1,0H, m), 8,16-8,21 (1,0H, m), 8,49-8,51 (1,0H, m), 8,87 (0,2H, s), 9,16 (0,6H, s), 9,74 (0,2H, s), 10,19 (0,6H, s), 10,53 (0,4H, s)

Ejemplo de Producción 18

(1) A una mezcla de 1,3 g de éster terc-butílico de ácido N'-isopropilidenehidrazinocarboxílico (un compuesto descrito in Sinlett (2004), 2355-2356), 0,44 g de hidróxido de potasio, 0,20 g de sulfato de tetrabutilamonio y 20 mL de tolueno, se le añadieron 1,05 g de 1,1,3-tricloro-2-propeno gota a gota a 50°C. La mezcla de reacción se agitó a 80°C durante 3,5 horas y se añadieron adicionalmente 0,44 g de 1,1,3-tricloro-2-propeno, seguido de agitación a 80°C durante 1 hora. Después de enfriar y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,74 g de una mezcla de éster terc-butílico de ácido N-(3,3-dicloro-2-propenil)-N'-isopropilidenehidrazinocarboxílico y éster terc-butílico de ácido N-(3,3-dicloro-2-propenil)hidrazinocarboxílico.

Éster terc-butílico de ácido N-(3,3-dicloro-2-propenil)-N'-isopropilidenehidrazinocarboxílico

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 1,47 (9H, s), 1,88 (3H, s), 2,07 (3H, s), 4,18 (2H, d, J = 7 Hz), 6,02 (1H, t, J = 7 Hz)

Éster terc-butílico de ácido N-(3,3-dicloro-2-propenil)hidrazinocarboxílico

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 1,48 (9H, s), 4,01 (2H, s ancho), 4,11 (2H, d, J = 7 Hz), 5,99 (1H, t, J = 7 Hz)

(2) Una mezcla de 0,74 g de la mezcla de éster terc-butílico de ácido N-(3,3-dicloro-2-propenil)-N'-isopropilidenehidrazinocarboxílico y éster terc-butílico de ácido N-(3,3-dicloro-2-propenil)hidrazinocarboxílico y 20 mL de una solución de cloruro de hidrógeno-etanol se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para obtener 0,48 g de hidrocloreuro de 3,3-dicloro-2-propenilhidrazina.

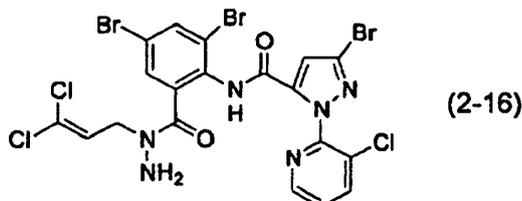
Hidrocloreuro de 3,3-dicloro-2-propenilhidrazina

RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 3,36 (2H, s ancho), 3,63 (2H, d, J = 7 Hz), 6,28 (1H, t, J = 7 Hz), 9,36 (2H, s)

(3) Una mezcla de 0,63 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,48 g de hidrocloreuro de 3,3-dicloro-2-propenilhidrazina, 0,93 g de carbonato de potasio y 10 mL de N,N-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante 1,5 horas. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con metil terc-butil éter. La capa orgánica se lavó sucesivamente con agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 0,23 g del compuesto (2-16) y 0,18 g del compuesto (2-17).

Compuesto (2-16)

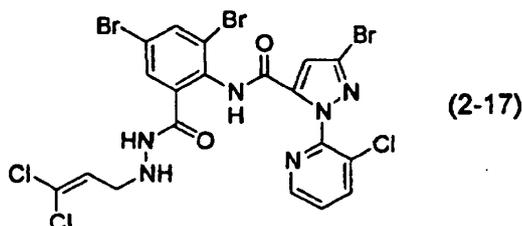
[Fórmula Química 162]



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 3,97 (2,0H, s ancho), 4,27-4,33 (2,0H, m), 5,88-5,90 (1,0H, m), 7,15 (0,5H, s), 7,23 (0,5H, s), 7,34-7,43 (2,0H, m), 7,59-7,64 (1,0H, m), 7,85-7,92 (1,0H, m), 8,46-8,50 (1,0H, m), 9,30 (0,5H, s ancho), 9,43 (0,5H, s ancho)

Compuesto (2-17)

[Fórmula Química 163]

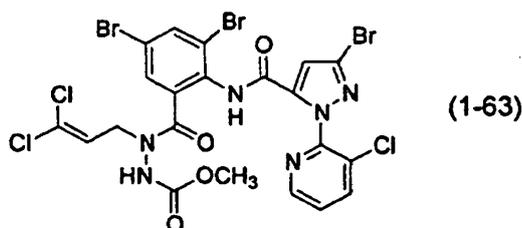


H-NMR (CDCl₃) δ: 3,62 (2H, t, J = 7 Hz), 4,76-4,80 (1H, m), 5,99 (1H, t, J = 7 Hz), 7,16 (1H, s), 7,36 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,43 (1H, d, J = 2 Hz), 7,67-7,71 (2H, m), 7,86 (1H, dd, J = 8 Hz, 1 Hz), 8,45 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 9,15 (1H, s)

(4) A la mezcla de 0,17 g del compuesto (2-16) y 3 mL de piridina, se le añadieron 75 μL de cloroformiato de metilo gota a gota enfriando con hielo. Mientras la mezcla de reacción se agitaba a temperatura ambiente durante 8 horas, se añadieron tres veces 75 μL de cloroformiato de metilo. Después de añadir agua, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo resultante, se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,11 g del presente compuesto (1-63).

Presente compuesto (1-63)

[Fórmula Química 164]



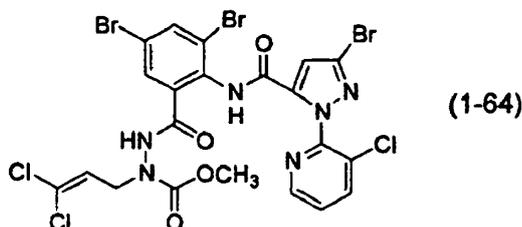
RMN H¹ (CDCl₃) δ: 3,58-3,82 (3H, m ancho), 4,22-4,24 (2H, m), 5,96 (1H, t, J = 7 Hz), 7,13 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,59 (1H, s ancho), 7,82 (1H, d, J = 2 Hz), 7,87 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,11 (1H, s ancho), 8,42 (1H, dd, J = 5 Hz, 1 Hz), 8,97 (1H, s ancho)

Ejemplo de Producción 19

En lugar del compuesto (2-16) del Ejemplo de Producción 18 (4), se utilizó el compuesto (2-17) para obtener el presente compuesto (1-64).

Presente compuesto (1-64)

[Fórmula Química 165]



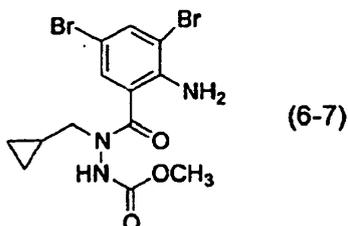
RMN H¹ (CDCl₃) δ: 3,64 (3H, s), 4,31 (2H, d, J = 7 Hz), 5,87 (1H, t, J = 7 Hz), 7,17 (1H, s), 7,40-7,49 (3H, m), 7,68 (1H, s), 7,91 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,49 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,10 (1H, s)

Ejemplo de Producción 20

(1) A una mezcla de 1,5 g de N-(2-amino-3,5-dibromobenzoil)-N'-metoxicarbonilhidrazina (un compuesto obtenido en el Ejemplo de Producción 12(1)), 0,68 g de carbonato de potasio y 18 mL de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 0,50 g de (bromometil)ciclopropano gota a gota enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 20 horas y se agitó adicionalmente a 60°C durante 4 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,39 g del compuesto (6-7).

Compuesto (6-7)

[Fórmula Química 166]



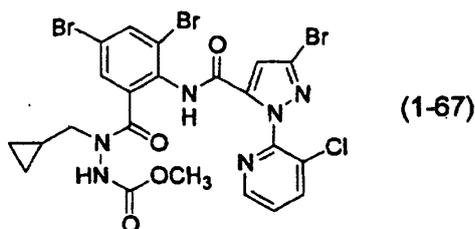
RMN H^1 ($CDCl_3$) δ : 0,18-0,24 (2H, m), 0,54-0,57 (2H, m), 0,97-1,06 (1H, m), 3,44 (2H, s ancho), 3,76 (3H, s), 4,96 (2H, s ancho), 7,10 (1H, s ancho), 7,28 (1H, d, J = 2 Hz), 7,58 (1H, d, J = 2 Hz)

(2) Una mezcla de 0,31 g de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxílico, 0,35 g de dicloruro de oxalilo, 3 gotas de N,N-dimetilformamida y 3 mL de tolueno se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para preparar un cloruro de ácido.

A continuación, la mezcla del cloruro de ácido, 0,39 g del compuesto (6-7), 500 μ L de piridina y 500 μ L de xileno se agitó a 100°C durante 1 hora. Después de enfriar a temperatura ambiente y añadir agua, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó sucesivamente con ácido clorhídrico 1 N, agua y una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener el presente compuesto (1-67).

Presente compuesto (1-67)

[Fórmula Química 167]



RMN H^1 ($CDCl_3$) δ : 0,16 (2H, s ancho), 0,40 (2H, s ancho), 0,78-0,90 (1H, m), 3,12-3,83 (5H, m), 7,28 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,45 (1H, d, J = 2 Hz), 7,59 (1H, s), 7,61 (1H, d, J = 2 Hz), 7,85 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,44 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,62 (1H, s ancho)

Los presentes compuestos producidos mediante procedimientos de acuerdo con los de los Ejemplos de Producción descritos anteriormente se muestran en la Tabla 69 a la Tabla 73 junto con los números de compuesto.

[Fórmula Química 168]

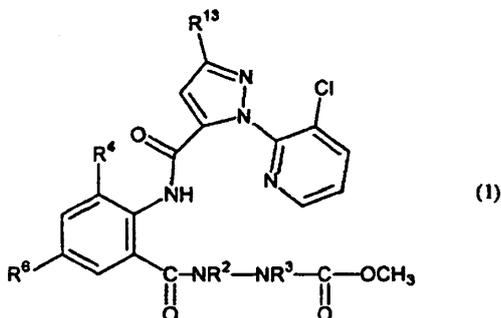


Tabla 69

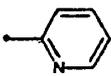
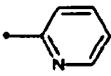
Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-1	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 1(6)
1-2	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	Br	Br	Br	
1-3	CH ₃	CH ₂ CN	Br	Br	Br	
1-4	CH ₂ CN	CH ₃	Br	Br	Br	
1-5	H		Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 5(2)
1-6	H		CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 6(2)
1-7	CH ₂ CH=CH ₂	H	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 7(2)
1-8	H	CH ₂ CH=CH ₂	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 7(2)
1-9	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 8(2)
1-10	H	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 8(2)
1-11	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 9(2)
1-12	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 10

Tabla 70

Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-13	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	CN	Br	
1-14	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CN	Br	
1-15	CH ₂ CH=CH ₂	H	Br	Br	Cl	
1-16	H	CH ₂ CH-CH ₂	Br	Br	Cl	
1-17	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	Cl	Cl	
1-18	H	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Cl	Cl	
1-19	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	Cl	Cl	
1-20	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	Cl	Cl	
1-21	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	CN	Cl	
1-22	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CN	Cl	
1-23	CH ₂ CH=CH ₂	H	Br	Br	CF ₃	
1-24	H	CH ₂ CH=CH ₂	Br	Br	CF ₃	

ES 2 389 965 T3

Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-25	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	Cl	CF ₃	
1-26	H	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Cl	CF ₃	
1-27	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	Cl	CF ₃	
1-28	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	Cl	CF ₃	
1-29	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	CN	CF ₃	
1-30	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CN	CF ₃	

Tabla 71

Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-31	CH ₂ C≡CH	H	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 11(2)
1-32	H	CH ₂ C≡CH	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 11(2)
1-33	CH ₂ C≡CH	H	Cl	Cl	Br	
1-34	H	CH ₂ C≡CH	Cl	Cl	Br	
1-35	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 13(3)
1-36	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	Cl	Br	
1-37	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	CN	Br	
1-38	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CN	Br	
1-39	CH ₂ C≡CH	H	Br	Br	Cl	
1-40	H	CH ₂ C≡CH	Br	Br	Cl	
1-41	CH ₂ C≡CH	H	Cl	Cl	Cl	
1-42	H	CH ₂ C≡CH	Cl	Cl	Cl	
1-43	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	Cl	Cl	
1-44	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	Cl	Cl	
1-45	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	CN	Cl	
1-46	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CN	Cl	
1-47	CH ₂ C≡CH	H	Br	Br	CF ₃	
1-48	H	CH ₂ C≡CH	Br	Br	CF ₃	

Tabla 72

Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-49	CH ₂ C≡CH	H	Cl	Cl	CF ₃	
1-50	H	CH ₂ C≡CH	Cl	Cl	CF ₃	
1-51	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	Cl	CF ₃	
1-52	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	Cl	CF ₃	

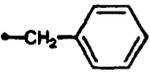
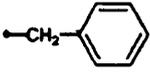
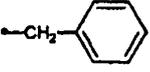
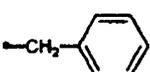
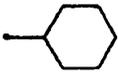
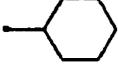
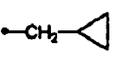
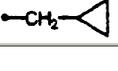
Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-53	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	CN	CF ₃	
1-54	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CN	CF ₃	
1-55		H	Br	Br	Br	
1-56	H		Br	Br	Br	
1-57		H	CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 14(2)
1-58	H		CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 14 (2)
1-59	H		Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 15(2)
1-60	H		CH ₃	Cl	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 15 (2)

Tabla 73

Número de Compuesto	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	R ¹³	Propiedades
1-61	CH ₂ CH ₂ OH	H	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 17 (2)
1-62	CH ₂ CH ₂ OH	H	CH ₃	Cl	Br	
1-63	CH ₂ CH=CCl ₂	H	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 18(4)
1-64	H	CH ₂ CH=CCl ₂	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 19
1-65	CH ₂ CH=CCl ₂	H	CH ₃	Cl	Br	
1-66	H	CH ₂ CH=CCl ₂	CH ₃	Cl	Br	
1-67		H	Br	Br	Br	Descritas en el Ejemplo de Producción 20(2)
1-68		H	CH ₃	Cl	Br	

Más adelante, se muestran los Ejemplos de Formulación. Todas las partes son en peso.

Ejemplo de Formulación 1

5 En una mezcla de 35 partes de xileno y 35 partes de N,N-dimetilformamida, se disuelven 10 partes de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68), y a continuación se añaden 14 partes de polioxietileno estirilfenil éter y 6 partes de dodecilsulfonato de calcio, seguido de agitación para obtener un concentrado emulsionable al 10%.

Ejemplo de Formulación 2

10 A una mezcla de 4 partes de laurilsulfato de sodio, 2 partes de lignosulfonato de calcio, 20 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético y 54 partes de tierra de diatomeas, se le añaden 20 partes de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68), seguido de agitación para obtener una formulación mojabla al 20%.

Ejemplo de Formulación 3

15 A 2 partes de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68), se les añaden 1 parte de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 2 partes de lignosulfonato de calcio, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla de caolín, y a continuación se agita cuidadosamente. Después, se añade una cantidad apropiada de agua a la mezcla, seguido de agitación, granulación con una granuladora y se seca con aire forzado para obtener una formulación granular al 2%.

Ejemplo de Formulación 4

25 En una cantidad apropiada de acetona, se disuelve 1 parte de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68), y a continuación se añaden 5 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 0,3 partes de PAP y 93,7 partes de arcilla fubasami, seguido de agitación y eliminación de la acetona de la mezcla mediante evaporación para obtener una formulación de polvo al 1%.

Ejemplo de Formulación 5

30 Una mezcla de 10 partes de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68), 35 partes de hulla blanca que contiene 50 partes de sal de amonio de polioxietilenoalquiletersulfato, y 55 partes de agua se tritura finamente mediante un método de molturación en mojado para obtener una formulación de pasta líquida al 10%.

Ejemplo de Formulación 6

35 En 5 partes de xileno y 5 partes de tricloroetano, se disuelven 0,1 partes de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68), y a continuación la solución se mezcla con 89,9 partes de queroseno desodorizado para obtener una solución oleosa al 0,1%.

Ejemplo de Formulación 7

40 En 0,5 mL de acetona, se disuelven 10 mg de cada uno de los presentes compuestos (1-1) a (1-68) y la solución se mezcla uniformemente con 5 g de un polvo de alimentación sólido para animales (polvo de alimentación sólido para cría y reproducción CE-2, fabricado por CLEA Japan, Inc.), y a continuación se seca mediante evaporación de la acetona para obtener un cebo envenenado.

Más adelante, la actividad de control de artrópodos nocivos del presente compuesto se muestra por medio de Ejemplos de Ensayo.

Ejemplo de Ensayo 1

50 La formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-12), (1-57), (1-58), (1-59), (1-60), (1-61), (1-63) y (1-64) obtenida en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm. Adicionalmente, la formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-11), (1-31) y (1-32) se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 200 ppm. De este modo, se prepararon soluciones para pulverización de ensayo.

60 Por otro lado, se plantó col en una copa de polietileno, y se cultivó hasta que se desarrolló la tercera hoja verdadera o la cuarta hoja verdadera. La solución para pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 mL/copa sobre la col.

Después de secar la solución de pulverización sobre la col, se colocaron 10 larvas de polilla dorso de diamante (*Plutella *xilostella**) en el tercer instar sobre la col. Al cabo de 5 días, se contó el número de polillas dorso de diamante, y el valor de control se calculó por medio de la siguiente ecuación. Valor de control (%) = $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$ donde

65 Cb: número de gusanos en un grupo no tratado antes del tratamiento;

Cai: número de gusanos en un grupo no tratado en observación;
 Tb: número de gusanos en un grupo tratado antes del tratamiento;
 Tai: número de gusanos en un grupo tratado en observación.

- 5 Como resultado, el grupo tratado con cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-11), (1-12), (1-31), (1-32), (1-57), (1-58), (1-59), (1-60), (1-61), (1-63) y (1-64) exhibió un valor de control de 100%.

10 Ejemplo de Ensayo 2

La formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-12), (1-57), (1-58), (1-59), (1-61), (1-63) y (1-64) obtenida en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm. Adicionalmente, la formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-11), (1-31) y (1-32) se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 200 ppm. De este modo, se prepararon soluciones de pulverización de ensayo.

15 Por otro lado, se plantó pepino en una copa de polietileno, y se cultivó hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. Se colocaron alrededor de 30 pulgones del algodón (*Aphis gossypii*) sobre el pepino. Al cabo de un día, la solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 mL/copa sobre el pepino. Seis días después de la pulverización, se contó el número de pulgones del algodón, y se calculó un valor de control por medio de la siguiente ecuación.

$$20 \text{ Valor de control (\%)} = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

- 25 Como resultado, el grupo tratado con cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-11), (1-12), (1-31), (1-32), (1-57), (1-58), (1-59), (1-61), (1-63) y (1-64) exhibió un valor de control de 90% o más.

30 Ejemplo de Ensayo 3

La formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-12), (1-57), (1-58), (1-59), (1-60), (1-61), (1-63) y (1-64) obtenida en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm. Adicionalmente, la formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-11), (1-31) y (1-32) se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 200 ppm. De este modo, se prepararon soluciones de pulverización de ensayo.

35 Por otro lado, se plantó col en una copa de polietileno, y se cultivó hasta que se desarrolló la tercera hoja verdadera o la cuarta hoja verdadera. La solución para pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 mL/copa sobre la col. Después de secar la solución de pulverización pulverizada sobre la col, se colocaron sobre la col 10 larvas en el cuarto ínstar de gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*). Al cabo de 4 días, se contó el número de gusanos grises del tabaco supervivientes sobre las hojas de col, y se calculó un valor de control por medio de la siguiente ecuación.

$$40 \text{ Valor de control (\%)} = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

- 45 Como resultado, el grupo tratado con cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-11), (1-12), (1-31), (1-32), (1-57), (1-58), (1-59), (1-60), (1-61), (1-63) y (1-64) exhibió un valor de control de 80% o más.

50 Ejemplo de Ensayo 4

La formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-12), (1-60), (1-63) y (1-64) obtenida en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm. Adicionalmente, la formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-11), (1-31) y (1-32) se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 200 ppm. De este modo, se prepararon soluciones de pulverización de ensayo.

55 Por otro lado, 20 mL de la solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó a un plantón de manzano (plantón de 28 días de edad, altura del árbol: alrededor de 15 cm) plantado en una copa de plástico. El plantón de manzano se secó al aire hasta que el grado que la solución de pulverización pulverizada sobre el plantón de manzano se secó, y se liberaron alrededor de 30 larvas en el primer ínstar de tótrix de la fruta de verano (*Adoxophyes orana fasciata*). Siete días después de la pulverización, se contó el número de gusanos supervivientes sobre el plantón de manzano, y se calculó un valor de control por medio de la siguiente ecuación.

$$60 \text{ Valor de control (\%)} = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

65

Como resultado, el grupo tratado con cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-11), (1-12), (1-31), (1-32), (1-60), (1-63) y (1-64) exhibió un valor de control de 100%.

Ejemplo de Ensayo 5

5 La formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-12), (1-57), (1-58), (1-61), (1-63) y (1-64) obtenida en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm. Adicionalmente, la formulación de pasta líquida de cada uno de los presentes compuestos (1-31) y (1-32) se diluyó con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 200 ppm. De este modo, se prepararon soluciones de pulverización de ensayo.

10 Por otro lado, se plantó pepino en una copa de polietileno, y se cultivó hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. La solución para pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 mL/copa sobre el pepino. Después de secar la solución de pulverización, se cortó la primera hoja verdadera y a continuación se colocó sobre un papel de filtro (diámetro: 70 mm) que contenía agua en una copa de polietileno (diámetro: 110 mm). Sobre la hoja de pepino, se liberaron 20 larvas de trips amarillo de los cítricos (*Franklinella occidentalis*), y la copa de polietileno se tapó. Siete días después de la pulverización, se examinó el porcentaje de área de la hoja dañado por el insecto y se calculó un valor de control por medio de la siguiente ecuación.

$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

20 Como resultado, el grupo tratado con cada uno de los presentes compuestos (1-1), (1-5), (1-6), (1-7), (1-8), (1-9), (1-10), (1-12), (1-31), (1-32), (1-57), (1-58), (1-61), (1-63) y (1-64) exhibió un valor de control de 100%.

Aplicabilidad Industrial

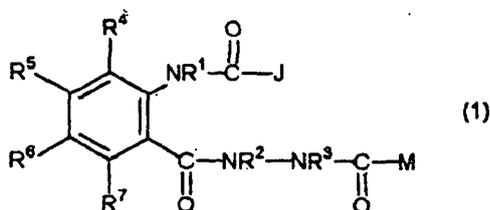
25 El presente compuesto tiene una actividad excelente para el control de artrópodos nocivos y por lo tanto es útil como agente activo de un agente para el control de artrópodos nocivos.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1)

5

[Fórmula Química 1]:



donde

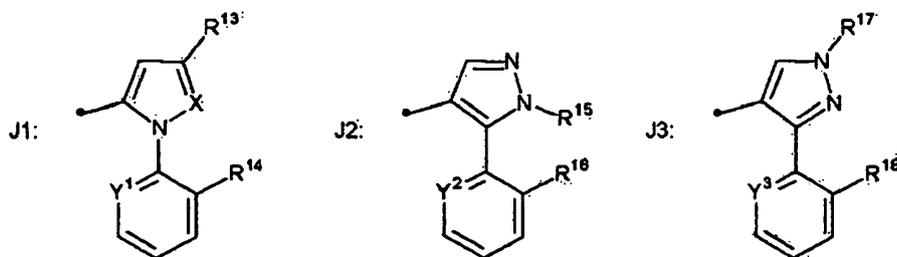
- 10 R^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C₂-C₆, un grupo alcoialquilo C₂-C₆, un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alquino C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo fenilalquilo C₇-C₉ cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo;
- 15 cada uno de R^2 y R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, o R^6 (en el que al menos uno de R^2 y R^3 es R^2), R^6 representa un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D mostrado más abajo, un grupo alqueno C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alquino C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo, un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo, un grupo alquil(C₁-C₆)tio halogenado opcionalmente, un "grupo alquil(C₁-C₆)sulfinilo halogenado opcionalmente, o un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo halogenado opcionalmente, grupo D:
- 25 (a) un grupo ciano,
 (b) un grupo nitro,
 (c) -C(=O)OR¹⁰¹ (R^{101} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₄),
 (d) -C(=O)NR¹⁰²R¹⁰³ (cada uno de R^{102} y R^{103} representa independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₄),
 30 (e) -C(=O)R¹⁰⁴ (R^{104} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo),
 (f) -CR¹⁰⁵=N-OR¹⁰⁶ (R^{105} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo, y R^{106} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-C₄),
 35 (g) -OR¹⁰⁷ (R^{107} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo),
 (h) -5(O)R¹⁰⁸ (R^{108} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo, y j representa un número entero de 0 a 2),
 (i) -NR¹⁰⁹R¹¹⁰ (cada uno de R^{109} y R^{110} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄, o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo),
 40 (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo,
 (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo,
 (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo,
 45 (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B mostrado más abajo, y
 (n) un grupo estirilo cuyo radical anular de benceno está sustituido opcionalmente con un sustituyente A mostrado más abajo);
- 50 R^4 representa un átomo de halógeno, o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente;
 cada uno de R^5 , R^6 y R^7 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, o
 R^5 y R^6 se pueden combinar para formare un grupo a 1,3-butadieno-1,4-diilo sustituido opcionalmente con un sustituyente C mostrado más abajo;
- 55 M representa -R⁸, -OR⁹, -SR¹⁰, o -NR¹¹R¹² {donde R^8 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alcoialquilo C₂-C₆, un grupo alqueno C₂-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquino C₂-C₆ halogenado opcionalmente, cada uno de R^9 , R^{10} , R^{11} y R^{12} representa independientemente un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alcoialquilo

C₃-C₆, un grupo alquenilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquinilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente};

J representa uno cualquiera de J1 a J3 mostrado más abajo:

5

[Fórmula Química 2]



{donde X representa un átomo de nitrógeno o CR¹⁹;

Y¹ representa un átomo de nitrógeno o CR²⁰;

Y² representa un átomo de nitrógeno o CR²¹;

Y³ representa un átomo de nitrógeno o CR²²;

cada uno de R¹³ y R¹⁹ representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alcoxi C₁-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alquil(C₁-C₆)tio halogenado opcionalmente, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfinilo halogenado opcionalmente, o un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo halogenado opcionalmente;

R¹⁵ y R¹¹ representan cada uno independientemente un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente;

cada uno de R¹⁴, R¹⁶, R²⁸, R²⁰, R²¹ y R²² representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, o un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente};

20 sustituyente A: un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente, y un grupo alcoxi C₁-C₆ halogenado opcionalmente;

sustituyente B: un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C₁-C₆; y

25 sustituyente C: un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo alquilo C₁-C₆ halogenado opcionalmente.

30 2. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D1 mostrado más abajo, un grupo alquenilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo alquinilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B;

35 grupo D1 : (a) un grupo ciano, (g) -OR¹⁰⁷ (R¹⁰⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A), (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A, (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B.

40 3. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 2, donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D2 mostrado más abajo, un grupo alquenilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente, o un grupo alquinilo C₃-C₆ halogenado opcionalmente;

45 grupo D2: (a) un grupo ciano y (g) -OR¹⁰⁷ (R¹⁰⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ o un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A).

50 4. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 2, donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D3 mostrado más abajo, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, o un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B;

55 grupo D3: (j) un grupo cicloalquilo C₃-C₆ sustituido opcionalmente con un sustituyente B, (k) un grupo fenilo sustituido opcionalmente con un sustituyente A, (l) un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente A, y (m) un grupo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con un sustituyente B.

5. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 3, donde, en la fórmula (1), uno de R^2 y R^3 es R^2 , y el otro es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente, y R^6 es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo ciano, un grupo alquenoilo C_3-C_6 halogenado opcionalmente, o un grupo alquinoilo C_3-C_6 halogenado opcionalmente.
- 5 6. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, donde, en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo D.
- 10 7. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 6, donde en la fórmula (1), R^G es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo ciano.
- 15 8. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 7, donde, en la fórmula (1), R^2 es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo ciano; y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente.
- 20 9. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 7, donde, en la fórmula (1), R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 halogenado opcionalmente; y R^3 es un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo ciano.
- 25 10. Un agente para el control de artrópodos nocivos que comprende el compuesto de hidrazida de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 como agente activo.
11. El uso del compuesto de hidrazida de acuerdo con uno cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 como agente activo de un agente para el control de artrópodos nocivos.
- 30 12. Un método para el control de artrópodos nocivos, que comprende aplicar el compuesto de hidrazida de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 directamente a los artrópodos nocivos, o aplicar a los hábitats de los artrópodos nocivos, donde el término "hábitats" significa plantas, suelos y casas.
13. El uso del compuesto de hidrazida de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para la producción de un agente para el control de artrópodos nocivos.