

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 398 677**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 487/04 (2006.01)

C07D 498/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **10.12.2008** **E 08858542 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.12.2012** **EP 2217600**

54 Título: **Pirazoles bicíclicos fungicidas**

30 Prioridad:

12.12.2007 US 7410

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

20.03.2013

73 Titular/es:

**E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)
1007 MARKET STREET
WILMINGTON, DE 19898, US**

72 Inventor/es:

**BISAHA, JOHN, JOSEPH;
CREWS, ALVIN, DONALD, JR.;
HOWARD, MICHAEL, HENRY, JR.;
SHARPE, PAULA, LOUISE;
STEVENSON, THOMAS, MARTIN y
TAGGI, ANDREW, EDMUND**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 398 677 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

Pirazoles bicíclicos fungicidas

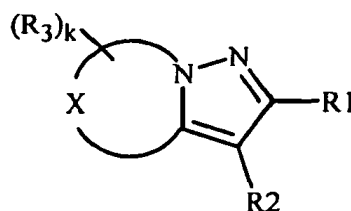
Campo de la invención

Esta invención se refiere a ciertos pirazoles bicíclicos, a sus N-óxidos, sales y a composiciones, y a procedimientos de su uso como fungicidas.

Antecedentes de la invención

El control de enfermedades de plantas provocadas por patógenos fúngicos de plantas es extremadamente importante para alcanzar una alta eficacia de cultivo. El daño de las plantas por enfermedades en cultivos de plantas ornamentales, de hortalizas, de cereales y de frutales puede causar una reducción significativa en la productividad y, de este modo, dar lugar a mayores costes para el consumidor. Hay muchos productos disponibles de forma comercial para estos fines, pero continúa la necesidad de nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más inocuos desde el punto de vista medioambiental o que tengan diferentes sitios de acción.

Se han descrito previamente ciertos pirazoles bicíclicos. La publicación de patente internacional WO 02/094833 describe derivados de pirrol de Fórmula i como agentes anticancerosos



i

en la que, *inter alia*, el anillo que contiene X es un anillo saturado de cinco o seis miembros; X es C, O o S; R₃ es independientemente, H o alquilo; k es 1 a 8; R₁ es fenilo no sustituido o sustituido y R₂ es pirimidina opcionalmente sustituida con alcoxi y alquilamino.

El documento EP 0531901 describe derivados de pirazol que son moduladores de interleucina-1 y del factor de necrosis tumoral.

El documento WO 02/094833 describe derivados de pirazol como inhibidores de la transducción de la señal TGF-beta.

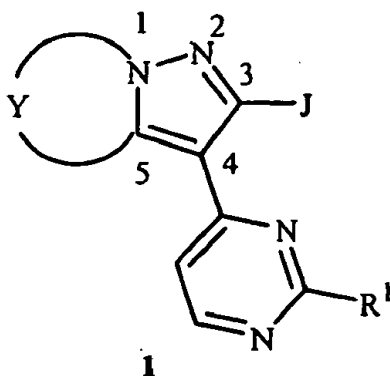
BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON,

ELSEVIER SCIENCE, GB, Vol. 14, nº 19, 4 de octubre de 2004, páginas 4945-4948 describe inhibidores de la síntesis de citocinas basados en 4-aril-5-pirimidilo de la producción de TNF-α, que contienen un núcleo heterocíclico de pirazol bicíclico.

El documento WO 97/02262 describe pirimidinonas fungicidas.

Compendio de la invención

Esta invención se refiere a compuestos de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), N-óxidos y sales de los mismos, a composiciones agrícolas que los contienen y a su uso como fungicidas:



en la que

Y

se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos (que se identifican con "1" y "5" respectivamente) formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $-C(R^2)=N-$, $-N=N-$, $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y $SiR^{5a}R^{5b}$;

cada R^2

es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, -CHO, -NHCHO, -N₃, -N=C=O, -N=C=S, -SH, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -C(=O)OR^{6a}, -C(=O)NHOR^{6a}, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, cicloalcoxi C₃-C₆, alquenilo C₂-C₅, haloalquenilo C₃-C₅, alquinilo C₂-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, haloalquilcarbonilo C₂-C₅, alcocicarbonilalcoxi C₃-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquilsulfino C₁-C₅, haloalquilsulfino C₁-C₅, cicloalquilsulfino C₃-C₆, alquilsulfono C₁-C₅, haloalquilsulfono C₁-C₅, cicloalquilsulfono C₃-C₆, alquilsililo C₃-C₅, haloalquilsililo C₃-C₅, alquilamino C₁-C₅, haloalquilamino C₁-C₅, cicloalquilamino C₃-C₆, dialquilamino C₂-C₅ o haloalquilamino C₃-C₅; o

 $\text{dos } \mathbb{R}^2$

unidos a átomos de carbono de anillo adyacentes se toman juntos formando un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado de 5 a 7 miembros, opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitró;

cada $\mathbb{R}^3$

es independientemente H, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -CHO, -NHCHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, hidroxil, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilo C₄-C₇, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, haloalquilcarbonilo C₂-C₅, cicloalquilcarbonilo C₄-C₇, alcocixarbonilo C₂-C₆, haloalcoxixarbonilo C₂-C₆, cicloalcoxixarbonilo C₄-C₇, alcoxialquilcarbonilo C₃-C₆, alcoxialcoxixarbonilo C₃-C₆, (alquiltio)carbonilo C₂-C₆, alcoxi(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₇, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₆, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₆, alcoxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilaminosulfonilo C₁-C₅, trialquilsililo C₃-C₅ o halotrialquilsililo C₃-C₅;

cada R^4

es independientemente H, ciano, amino, hidroxí, alquilo C₁-C₆,
cicloalquilo C₃-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆,
alcoxi C₁-C₆, fenilo o benzoilo;

cada R^{5a} y R^{5b}

es independientemente alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₅, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀,

		alquilocicloalquilo C ₄ -C ₇ , alquilocicloalquilalquilo C ₅ -C ₇ , haloalquilo C ₁ -C ₅ , alcoxi C ₁ -C ₅ o haloalcoxi C ₁ -C ₅ ;
	cada R ⁶	es independientemente H, alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₇ , alquilocicloalquilo C ₄ -C ₇ o bencilo;
5	cada R ^{6a}	es independientemente alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₇ o alquilocicloalquilo C ₄ -C ₇ ;
10	J	es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos bicclico naftalenilo o heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R ⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R ⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno; o
15	J	es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} y S(=O) _p (=NR ⁴) _q , cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R ⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R ⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno;
20	cada R ⁷	es independientemente halógeno, alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , alquilocicloalquilo C ₄ -C ₇ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , haloalquenilo C ₂ -C ₆ , ciano, nitro, alcoxi C ₁ -C ₆ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , alquiltio C ₁ -C ₆ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₆ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₆ , haloalquiltio C ₁ -C ₆ , haloalquilsulfonilo C ₁ -C ₆ , haloalquilsulfonilo C ₁ -C ₆ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₆ , alcocixarbonilo C ₂ -C ₆ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₆ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₆ o trialquilsililo C ₃ -C ₆ ;
30	R ⁸ R ¹	es alquilo C ₁ -C ₃ ; es -NR ^{9a} R ^{9b} , -NR ¹⁰ -NR ^{11a} R ^{11b} , -OR ¹² , -N=CR ^{13a} R ^{13b} o -NR ¹⁰ N=CR ^{14a} R ^{14b}
35	cada R ^{9a} y R ^{11a}	es independientemente H, alquilo C ₁ -C ₁₀ , alquenilo C ₂ -C ₁₀ , alquinilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilo C ₁ -C ₁₀ , haloalquenilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquinilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , alcóxialquenilo C ₃ -C ₁₀ , alcóxialquinilo C ₃ -C ₁₀ , dialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , trialcoxialquilo C ₄ -C ₁₀ , haloalcóxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcóxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , hidroxialquilo C ₁ -C ₁₀ , cianoalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquiltioalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilsulfonilalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , haloalquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , cicloalquilaminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , dialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , halodialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₆ -C ₁₀ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilcarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcocixarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcocixarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalcocixarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcóxialquilcarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alcóxialcocixarbonilo C ₃ -C ₁₀ , (alquiltio)carbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxi(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquiltio(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilaminocarbonilo C ₄ -C ₁₀ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alquilamino(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , dialquilamino(tiocarbonilo) C ₃ -C ₁₀ , alquilsulfonilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilsulfonilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxi(alquil)aminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alcóxi C ₁ -C ₁₀ , haloalcoxi C ₁ -C ₁₀ , cicloalcoxi C ₃ -C ₁₀ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₁₀ , haloalquilsulfonilo C ₁ -C ₁₀ , cicloalquilsulfonilo C ₃ -C ₁₀ , alquilaminosulfonilo C ₁ -C ₁₀ , dialquilaminosulfonilo C ₂ -C ₁₀ o - (CR ^{15a} R ^{15b}) _m R ¹⁶ ;
55	cada R ^{9b} y R ^{11b}	es independientemente H, alquilo C ₁ -C ₁₀ , alquenilo C ₂ -C ₁₀ , alquinilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilo C ₁ -C ₁₀ , haloalquenilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquinilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , alcóxialquenilo C ₃ -C ₁₀ , alcóxialquinilo C ₃ -C ₁₀ , dialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , trialcoxialquilo C ₄ -C ₁₀ , haloalcóxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcóxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcóxihaloalquilo

5		C ₂ -C ₁₀ , hidroxialquilo C ₁ -C ₁₀ , cianoalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquiltioalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilsulfinilalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , haloalquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , cicloalquilaminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , dialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , halodialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₆ -C ₁₀ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilcarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcoxycarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcoxycarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalcoxycarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcoxialquilcarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialcoxycarbonilo C ₃ -C ₁₀ , (alquiltio)carbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquiltio(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilaminocarbonilo C ₄ -C ₁₀ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alquilamino(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , dialquilamino(tiocarbonilo) C ₃ -C ₁₀ , alquilsulfonylaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilsulfonylaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxil(alquil)aminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alquilsulfonyl C ₁ -C ₁₀ , haloalquilsulfonyl C ₁ -C ₁₀ , cicloalquilsulfonyl C ₃ -C ₁₀ , alquilaminosulfonyl C ₁ -C ₁₀ , dialquilaminosulfonyl C ₂ -C ₁₀ o - (CR ^{15a} R ^{15b}) _m R ¹⁶ ; o
10		
15		
20	cada pareja de R ^{9a} y R ^{9b} , o pareja de R ^{11a} y R ^{11b}	se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de carbono y heteroátomos, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR ³ , C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} y S(=O) _p (=NR ⁴) _q , y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, -CN, alquilo C ₁ -C ₂ y alcoxil C ₁ -C ₂ ;
25		
30	R ¹²	es H, alquilo C ₁ -C ₁₀ , alquenilo C ₂ -C ₁₀ , alquinilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilo C ₁ -C ₁₀ , haloalquenilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquinilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialquenilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialquinilo C ₃ -C ₁₀ , dialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , trialcoxialquilo C ₄ -C ₁₀ , haloalcoxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcoxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , hidroxialquilo C ₂ -C ₁₀ , cianoalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquiltioalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilsulfinilalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , haloalquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , cicloalquilaminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , dialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , halodialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₆ -C ₁₀ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilcarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcoxycarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcoxycarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalcoxycarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcoxialquilcarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialcoxycarbonilo C ₃ -C ₁₀ , (alquiltio)carbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquiltio(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilaminocarbonilo C ₄ -C ₁₀ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alquilamino(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , dialquilamino(tiocarbonilo) C ₃ -C ₁₀ , alquilsulfonylaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilsulfonylaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxil(alquil)aminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ o -(CR ^{15a} R ^{15b}) _m R ¹⁶ ;
35		
40		
45	cada R ^{15a} y R ^{15b}	es independientemente H, halógeno, alquilo C ₁ -C ₅ , haloalquilo C ₁ -C ₅ o alcoxil C ₁ -C ₅ ; o una pareja geminal de R ^{15a} y R ^{15b} se toma junto con el átomo de carbono al que está unida formando -C(=O)- o un anillo cicloalquilo C ₃ -C ₆ o halocicloalquilo C ₃ -C ₆ ; o
50	R ^{15a} y R ^{15b}	unidos a átomos de carbono adyacentes se toman junto con los átomos de carbono a los que están unidos formando un anillo cicloalquilo C ₃ -C ₆ o halocicloalquilo C ₃ -C ₆ ;
55	cada R ¹⁶	es independientemente fenilo, cicloalquilo C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , cicloalcoxil C ₃ -C ₈ , cicloalqueniloxil C ₃ -C ₈ , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} y S(=O) _p (=NR ⁴) _q ; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R ¹⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R ⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno; con la condición de que
60		

		cuando R^{12} es $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$ y m es 0, entonces R^{16} es distinto de cicloalcoxi C ₃ -C ₈ o cicloalquenilo C ₃ -C ₈ ;
5	cada R^{17}	es halógeno, alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , alquilocicloalquilo C ₄ -C ₁₀ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , haloalquenilo C ₂ -C ₆ , ciano, nitro, alcoxi C ₁ -C ₆ , cicloalcoxi C ₃ -C ₈ , halocicloalcoxi C ₃ -C ₈ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , alquiltio C ₁ -C ₆ , alquilsulfino C ₁ -C ₆ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₆ , haloalquiltio C ₁ -C ₆ , haloalquilsulfino C ₁ -C ₆ , haloalquilsulfonilo C ₁ -C ₆ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₆ , alcoxycarbonilo C ₂ -C ₆ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₆ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₆ , trialquilsililo C ₃ -C ₆ , fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;
	cada m	es independientemente 0, 1 o 2;
15	cada R^{10}	es independientemente H, alquilo C ₁ -C ₅ , alquenilo C ₂ -C ₅ , alquinilo C ₂ -C ₅ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₅ , haloalquenilo C ₂ -C ₅ , haloalquinilo C ₂ -C ₅ , alcoxialquilo C ₂ -C ₅ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₅ o alcoxi C ₁ -C ₅ ;
20	cada R^{13a} y R^{13b}	es independientemente H, -CN, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₈ , halocicloalquilo C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilocicloalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilocicloalquilalquilo C ₅ -C ₁₀ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ , alquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , haloalquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilaminoalquilo C ₄ -C ₆ , dialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , halodialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , alcoxi C ₁ -C ₆ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , cicloalcoxi C ₃ -C ₁₀ , alquiltio C ₁ -C ₁₀ , haloalquiltio C ₁ -C ₁₀ , cicloalquiltio C ₃ -C ₁₀ , trialquilsililo C ₃ -C ₁₀ o halotrialquilsililo C ₃ -C ₁₀ ; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₃ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₃ ; o
35	R^{13a} y R^{13b}	se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ o $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y opcionalmente sustituidos en miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₂ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₂ ;
40	cada R^{14a} y R^{14b}	es independientemente H, -CN, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₈ , halocicloalquilo C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilocicloalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilocicloalquilalquilo C ₅ -C ₁₀ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ , alquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , haloalquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilaminoalquilo C ₄ -C ₆ , dialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , halodialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , alcoxi C ₁ -C ₆ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , cicloalcoxi C ₃ -C ₁₀ , alquiltio C ₁ -C ₁₀ , haloalquiltio C ₁ -C ₁₀ , cicloalquiltio C ₃ -C ₁₀ , trialquilsililo C ₃ -C ₁₀ o halotrialquilsililo C ₃ -C ₁₀ ; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ o $S(=O)_p(=NR^4)_q$, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₃ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₃ ; o
60	R^{14a} y R^{14b}	se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$,

$C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ o $S(=O)_p(=NR^3)_q$ y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_2 ;

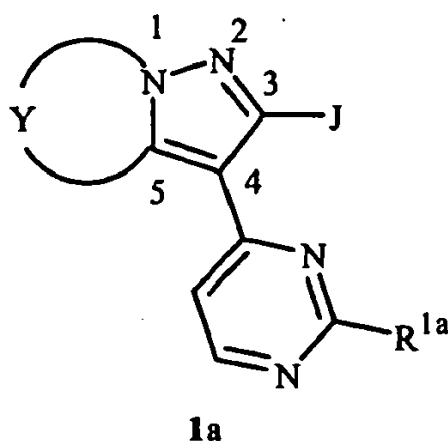
p y q

son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de $S(=O)_p(=NR^3)_q$, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2; y

cada R^{18}

es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 o alquilcicloalquilo C_4-C_7 .

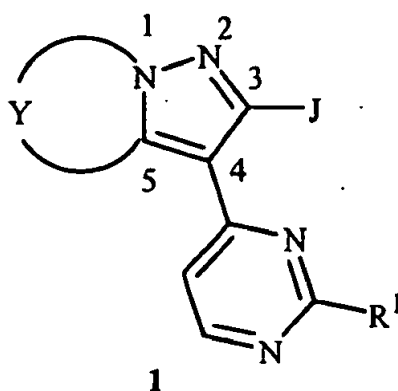
Esta invención también se refiere a un compuesto de Fórmula **1a** (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos y sales del mismo; y al uso de dicho compuesto para preparar compuestos de Fórmula **1** (incluyendo *N*-óxidos y sales de los mismos),



en la que R^{1a} es halógeno, $-SCH_3$, $-S(=O)CH_3$, $-S(=O)_2CH_3$, $-OS(=O)_2CH_3$, $-S(=O)_2CF_3$ o $-OS(=O)_2Ph-p-CH_3$; y J e Y se definen como antes para la Fórmula **1**.

Más en particular, esta invención se refiere a un compuesto de Fórmula **1** o **1a** (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), un *N*-óxido o una sal del mismo. Esta invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de Fórmula **1** como se ha definido antes y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos.

Esta invención se refiere también a una composición fungicida que comprende una mezcla de un compuesto de Fórmula **1**, *N*-óxidos y sales del mismo,



en la que

Y

se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $-C(R^2)=N-$, $-N=N-$, $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $S(=O)_p(=NR^3)_q$ y $SiR^{5a}R^{5b}$;

5	cada R ²	es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, -CHO, -NHCHO, -N ₃ , -N=C=O, -N=C=S, -SH, -C(=O)NH ₂ , -C(=O)NHCN, -C(=O)OR ⁶ , -C(=O)NHOR ^{6a} , alquilo C ₁ -C ₅ , alqueno C ₂ -C ₅ , alquino C ₂ -C ₅ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalqueno C ₃ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₅ , alcoxi C ₁ -C ₅ , haloalcoxi C ₁ -C ₅ , cicloalcoxi C ₃ -C ₆ , alqueno C ₂ -C ₅ , haloalqueno C ₃ -C ₅ , alquino C ₂ -C ₅ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₅ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₅ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₅ , alcoxycarbonilalcoxi C ₃ -C ₅ , alquiltio C ₁ -C ₅ , haloalquiltio C ₁ -C ₅ , cicloalquiltio C ₃ -C ₆ , alquil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₅ , alquiltio(tiocarbonilo) C ₂ -C ₅ , alquilsulfino C ₁ -C ₅ , haloalquilsulfino C ₁ -C ₅ , cicloalquilsulfino C ₃ -C ₆ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₅ , haloalquilsulfonilo C ₁ -C ₅ , cicloalquilsulfonilo C ₃ -C ₆ , trialquilsililo C ₃ -C ₅ , halotrialquilsililo C ₃ -C ₅ , alquilamino C ₁ -C ₅ , haloalquilamino C ₁ -C ₅ , cicloalquilamino C ₃ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₅ o halodialquilamino C ₃ -C ₅ ; o
15	dos R ²	unidos a átomos de carbono de anillo adyacentes se toman juntos formando un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado de 5 a 7 miembros, opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C ₁ -C ₄ , haloalquilo C ₁ -C ₄ , alcoxi C ₁ -C ₄ , haloalcoxi C ₁ -C ₄ , halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;
20	cada R ³	es independientemente H, -CN, -C(=O)NH ₂ , -C(=O)NHCN, -CHO, -NHCHO, -C(=O)OR ⁶ , -C(=O)NHOR ^{6a} , hidroxilo, alquilo C ₁ -C ₅ , alqueno C ₂ -C ₅ , alquino C ₂ -C ₅ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalqueno C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilcicloalquilo C ₄ -C ₇ , alquilcicloalquilalquilo C ₅ -C ₇ , haloalquilo C ₁ -C ₅ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₅ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₅ , cicloalquilcarbonilo C ₄ -C ₇ , alcoxycarbonilo C ₂ -C ₆ , haloalcoxycarbonilo C ₂ -C ₆ , cicloalcoxycarbonilo C ₄ -C ₇ , alcoxialquilcarbonilo C ₃ -C ₆ , alcoxialcoxycarbonilo C ₃ -C ₆ , (alquiltio)carbonilo C ₂ -C ₆ , alcoxi(tiocarbonilo) C ₂ -C ₆ , alquil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₆ , alquiltio(tiocarbonilo) C ₂ -C ₆ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilaminocarbonilo C ₄ -C ₇ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₆ , alquilamino(tiocarbonilo) C ₂ -C ₆ , dialquilamino(tiocarbonilo) C ₃ -C ₆ , alcoxialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₆ , alcoxialcoxi C ₁ -C ₅ , haloalcoxi C ₁ -C ₅ , alquiltio C ₁ -C ₅ , haloalquiltio C ₁ -C ₅ , cicloalquiltio C ₃ -C ₆ , alquilaminosulfonilo C ₁ -C ₅ , trialquilsililo C ₃ -C ₅ o halotrialquilsililo C ₃ -C ₅ ;
35	cada R ⁴	es independientemente H, ciano, amino, hidroxilo, alquilo C ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₁₀ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₆ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₆ , alcoxi C ₁ -C ₆ , fenilo o benzoilo;
40	cada R ^{5a} y R ^{5b}	es independientemente alquilo C ₁ -C ₅ , alqueno C ₂ -C ₅ , alquino C ₂ -C ₅ , cicloalquilo C ₃ -C ₅ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilcicloalquilo C ₄ -C ₇ , alquilcicloalquilalquilo C ₅ -C ₇ , haloalquilo C ₁ -C ₅ , alcoxi C ₁ -C ₅ o haloalcoxi C ₁ -C ₅ ;
	cada R ⁶	es independientemente H, alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₇ , alquilcicloalquilo C ₄ -C ₇ o bencilo;
45	cada R ^{6a}	es independientemente alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₇ o alquilcicloalquilo C ₄ -C ₇ ;
50	J	es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R ⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R ⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno; o
55	J	es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} y S(=O) _p (=NR ⁴) _q , cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R ⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R ⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

5	cada R⁷ R⁸ R¹	es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfino C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alcóxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆ o trialquilsililo C₃-C₆; es alquilo C₁-C₃; es H, -NR^{9a}R^{9b}, -NR¹⁰-NR^{11a}R^{16b}, -OR¹², -N=CR^{13a}R^{13b} o -NR¹⁰N=CR^{14a}R^{14b};
15	cada R^{9a} y R^{11a}	es independientemente H, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₂-C₁₀, alcóxialquilo C₂-C₁₀, alcóxialcóxialquilo C₃-C₁₀, alcóxialquenilo C₃-C₁₀, alcóxialquinilo C₃-C₁₀, dialcóxialquilo C₃-C₁₀, trialcóxialquilo C₄-C₁₀, haloalcóxialquilo C₂-C₁₀, alcóxihaloalquilo C₂-C₁₀, haloalcóxihaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfinalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcóxicarbonilo C₂-C₁₀, haloalcóxicarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcóxicarbonilo C₄-C₁₀, alcóxialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcóxialcóxicarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcóxi(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcóxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀, alcóxi C₁-C₁₀, haloalcóxi C₁-C₁₀, cicloalcóxi C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₀, cicloalquilsulfonilo C₃-C₁₀, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₀, dialquilaminosulfonilo C₂-C₁₀ o - (CR^{15a}R^{15b})_mR¹⁶;
35	cada R^{9b} y R^{11b}	es independientemente H, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₂-C₁₀, alcóxialquilo C₂-C₁₀, alcóxialcóxialquilo C₃-C₁₀, alcóxialquenilo C₃-C₁₀, alcóxialquinilo C₃-C₁₀, dialcóxialquilo C₃-C₁₀, trialcóxialquilo C₄-C₁₀, haloalcóxialquilo C₂-C₁₀, alcóxihaloalquilo C₂-C₁₀, haloalcóxihaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfinalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcóxicarbonilo C₂-C₁₀, haloalcóxicarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcóxicarbonilo C₄-C₁₀, alcóxialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcóxialcóxicarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcóxi(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcóxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₀, cicloalquilsulfonilo C₃-C₁₀, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₀, dialquilaminosulfonilo C₂-C₁₀ o - (CR^{15a}R^{15b})_mR¹⁶; o
60	cada pareja de R^{9a} y R^{9b}, o pareja de R^{11a} y R^{11b}	se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de carbono y heteroátomos, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4

		sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, -CN, alquilo C ₁ -C ₂ y alcoxi C ₁ -C ₂ ;
5	R ¹²	es H, alquilo C ₁ -C ₁₀ , alquenilo C ₂ -C ₁₀ , alquinilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilo C ₁ -C ₁₀ , haloalquenilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquinilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialquenilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialquinilo C ₃ -C ₁₀ , dialcoxialquilo C ₃ -C ₁₀ , trialcoxialquilo C ₄ -C ₁₀ , haloalcoxialquilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcoxihaloalquilo C ₂ -C ₁₀ , hidroxialquilo C ₂ -C ₁₀ , cianoalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquiltioalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilsulfinilalquilo C ₂ -C ₁₀ , alquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , haloalquilaminoalquilo C ₃ -C ₁₀ , cicloalquilaminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , dialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , halodialquilaminoalquilo C ₄ -C ₁₀ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₆ -C ₁₀ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilcarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilcarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcoxycarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalcoxycarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalcoxycarbonilo C ₄ -C ₁₀ , alcoxialquilcarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alcoxialcoxycarbonilo C ₃ -C ₁₀ , (alquiltio)carbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxi(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquil(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquiltio(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , cicloalquilaminocarbonilo C ₄ -C ₁₀ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ , alquilamino(tiocarbonilo) C ₂ -C ₁₀ , dialquilamino(tiocarbonilo) C ₃ -C ₁₀ , alquilsulfonilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , haloalquilsulfonilaminocarbonilo C ₂ -C ₁₀ , alcoxialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₁₀ o -(CR ^{15a} R ^{15b}) _m R ¹⁶ ;
10		
15	cada R ^{15a} y R ^{15b}	es independientemente H, halógeno, alquilo C ₁ -C ₅ , haloalquilo C ₁ -C ₅ o alcoxi C ₁ -C ₅ ; o una pareja geminal de R ^{15a} y R ^{15b} se toma junto con el átomo de carbono al que está unida formando -C(=O)- o un anillo cicloalquilo C ₃ -C ₆ o halocicloalquilo C ₃ -C ₆ ; o
20		
25	R ^{15a} y R ^{15b}	unidos a átomos de carbono adyacentes se toman junto con los átomos de carbono a los que están unidos formando un anillo cicloalquilo C ₃ -C ₆ o halocicloalquilo C ₃ -C ₆
30	cada R ¹⁶	es independientemente fenilo, cicloalquilo C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , cicloalcoxi C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} y S(=O) _p (=NR ⁴) _q ; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R ¹⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R ⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno; con la condición de que cuando R ¹² es -(CR ^{15a} R ^{15b}) _m R ¹⁶ y m es 0, entonces R ¹⁶ es distinto de cicloalcoxi C ₃ -C ₈ o cicloalquenilo C ₃ -C ₈ ;
35		
40		
45	cada R ¹⁷	es independientemente halógeno, alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , alquilcicloalquilo C ₄ -C ₁₀ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , haloalquenilo C ₂ -C ₆ , ciano, nitro, alcoxi C ₁ -C ₆ , cicloalcoxi C ₃ -C ₈ , halocicloalcoxi C ₃ -C ₈ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , alquiltio C ₁ -C ₆ , alquilsulfinilo C ₁ -C ₆ , alquilsulfonylo C ₁ -C ₆ , haloalquiltio C ₁ -C ₆ , haloalquilsulfinilo C ₁ -C ₆ , haloalquilsulfonylo C ₁ -C ₆ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₆ , alcoxycarbonilo C ₂ -C ₆ , alquilaminocarbonilo C ₂ -C ₆ , dialquilaminocarbonilo C ₃ -C ₆ , trialquilsililo C ₃ -C ₆ , fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;
50	cada m	es independientemente 0, 1 o 2;
55	cada R ¹⁰	es independientemente H, alquilo C ₁ -C ₅ , alquenilo C ₂ -C ₅ , alquinilo C ₂ -C ₅ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , halocicloalquilo C ₃ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₅ , haloalquenilo C ₂ -C ₅ , haloalquinilo C ₂ -C ₅ , alcoxialquilo C ₂ -C ₅ , alquilcarbonilo C ₂ -C ₅ o alcoxi C ₁ -C ₅ ;
	cada R ^{13a} y R ^{13b}	es independientemente H, -CN, -C(=O)OR ¹⁸ , alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₈ , halocicloalquilo C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilcicloalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilcicloalquilalquilo C ₅ -C ₁₀ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ ,

5		alquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , haloalquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilaminoalquilo C ₄ -C ₆ , dialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , halodialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , alcoxi C ₁ -C ₆ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , cicloalcoxi C ₃ -C ₁₀ , alquiltio C ₁ -C ₁₀ , haloalquiltio C ₁ -C ₁₀ , cicloalquiltio C ₃ -C ₁₀ , trialquilsililo C ₃ -C ₁₀ o halotrialquilsililo C ₃ -C ₁₀ ; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que
10		consiste en NR ³ , C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} y S(=O) _p (=NR ⁴) _q , cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₃ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₃ ; o
15	R ^{13a} y R ^{13b}	se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR ³ , C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} o S(=O) _p (=NR ⁴) _q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₂ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₂ ;
20	cada R ^{14a} y R ^{14b}	es independientemente H, -CN, -C(=O)OR ¹⁸ , alquilo C ₁ -C ₆ , alquenilo C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₈ , halocicloalquilo C ₃ -C ₈ , cicloalquenilo C ₃ -C ₈ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilocicloalquilo C ₄ -C ₁₀ , alquilocicloalquilalquilo C ₅ -C ₁₀ , alquilamino C ₁ -C ₆ , dialquilamino C ₂ -C ₆ , alquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , haloalquilaminoalquilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilaminoalquilo C ₄ -C ₆ , dialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , halodialquilaminoalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C ₅ -C ₁₀ , alcoxi C ₁ -C ₆ , haloalcoxi C ₁ -C ₆ , cicloalcoxi C ₃ -C ₁₀ , alquiltio C ₁ -C ₁₀ , haloalquiltio C ₁ -C ₁₀ , cicloalquiltio C ₃ -C ₁₀ , trialquilsililo C ₃ -C ₁₀ o halotrialquilsililo C ₃ -C ₁₀ ; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR ³ , C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} o S(=O) _p (=NR ⁴) _q , cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₃ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₃ ; o
25		
30		
35		
40	R ^{14a} y R ^{14b}	se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR ³ , C(=O), C(=S), C(=NR ⁴), SiR ^{5a} R ^{5b} o S(=O) _p (=NR ⁴) _q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C ₁ -C ₂ , halógeno, -CN y alcoxi C ₁ -C ₂ ;
45	p y q	son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de S(=O) _p (=NR ⁴) _q , con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2; y
	cada R ¹⁸	es independientemente alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquilalquilo C ₄ -C ₇ o alquilocicloalquilo C ₄ -C ₇ ; y al menos otro fungicida (por ejemplo, al menos un fungicida que tenga un sitio de acción diferente).
50	Esta invención se refiere además a un procedimiento para controlar enfermedades en plantas causadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o a una porción de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de la invención (es decir, como una composición descrita en el presente documento) en el que el compuesto de Fórmula 1 es como se acaba de definir antes.	
55	Esta invención se refiere también a un procedimiento para la preparación de un compuesto de Fórmula 1, como se acaba de definir antes, o un N-óxido, o una sal del mismo, que comprende poner en contacto un compuesto de Fórmula 1a, como se ha definido antes, con un compuesto de Fórmula 2	

o un agente reductor; en la que (a) cuando R^1 es distinto de hidrógeno, entonces el compuesto de Fórmula **1a** se pone en contacto con el compuesto de Fórmula **2** en presencia de una base; y (b) cuando R^1 es hidrógeno, entonces R^{1a} es halógeno y el compuesto de Fórmula **1a** se pone en contacto con el agente reductor.

Descripción detallada de la invención

5 Tal como se usa en la presente memoria, los términos "comprende," "que comprende," "incluye," que "incluye," "tiene," "que tiene," "contiene" o "que contiene" o cualquier otra de sus variaciones están destinados a cubrir una inclusión no exclusiva. Por ejemplo, una composición, un procedimiento, un método, un artículo o un aparato que comprenda una lista de elementos no está necesariamente limitado solo a esos elementos sino que puede incluir otros elementos no expresamente nombrados o inherentes a tal composición, procedimiento, método, artículo o aparato. Además, a menos que se exprese lo contrario, "o" se refiere a una "o" inclusiva y no a una "o" exclusiva. Por ejemplo, una condición A o B se satisface por cualquiera de lo siguiente: A es verdadero (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es verdadero (o está presente), y tanto A como B son verdaderos (o están presentes).

15 Asimismo, se pretende que los artículos indefinidos "un" y "uno(a)" que preceden a un elemento o componente de la invención no sean restrictivos con respecto al número de casos (es decir, sucesos) del elemento o componente. Por lo tanto, "un" o "uno(a)" deben leerse para que incluyan uno o al menos uno, y la forma singular de la palabra del elemento o componente también incluye el plural a menos que el número signifique obviamente que es el singular.

20 Tal como se hace referencia en la divulgación y las reivindicaciones presentes, "planta" incluye miembros del Reino de las Plantas, particularmente plantas de semilla (Spermatopsida), en todas las fases vitales, incluyendo plantas jóvenes (por ejemplo, semillas germinativas que se desarrollan en plántulas) y fases reproductivas maduras (por ejemplo, plantas que producen flores y semillas). Porciones de plantas incluyen miembros geotrópicos que crecen típicamente bajo la superficie del medio de crecimiento (por ejemplo, suelo), tales como raíces, tubérculos, bulbos y cormos, y también miembros que crecen por encima del medio de crecimiento, tales como follaje (incluyendo ramas y hojas), flores, frutos y semillas.

25 Tal como se hace referencia en la presente memoria, el término "plántula", bien usado solo, o bien en una combinación de palabras, significa una planta joven que se desarrolla a partir del embrión de una semilla.

30 En las indicaciones anteriores, el término "alquilo", usado solo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo" incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificada tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" también incluye polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificados tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuestos por múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo.

35 "Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alcoxialquilo" se refiere a una sustitución alcoxi sobre alquilo. Los ejemplos de "alcoxialquilo" incluyen CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. "Alqueniloxi" incluye restos alqueniloxi de cadena lineal o ramificada. Ejemplos de "alqueniloxi" incluyen $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquiniloxi" incluye restos alquiniloxi de cadena lineal o ramificada. Ejemplos de "alquiniloxi" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena lineal o ramificada tales como metiltio, etiltio, y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio.

45 "Alquilcarbonilo" denota restos alquilo de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{O})$. Ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})$ -. Ejemplos de "alcoxycarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ -, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ - y los diferentes isómeros de butoxi- o pentoxycarbonilo. "Alquil(tiocarbonilo)" denota restos alquilo de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{S})$. Ejemplos de "alquil(tiocarbonilo)" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{S})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{S})$ -. "(Alquiltio)carbonilo" denota restos alquiltio de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{O})$. Ejemplos de "(alquiltio)carbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{SC}(=\text{O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SC}(=\text{O})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHSC}(=\text{O})$ -. "Alcoxi(tiocarbonilo)" denota restos alcoxi de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{S})$. Ejemplos de "alcoxi(tiocarbonilo)" incluyen $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{S})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{S})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{S})$ -. "Alquiltio(tiocarbonilo)" denota restos alquiltio de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{S})$. Ejemplos de "alquiltio(tiocarbonilo)" incluyen $\text{CH}_3\text{SC}(=\text{S})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SC}(=\text{S})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHSC}(=\text{S})$ -. Ejemplos de "alquilaminocarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ y los diferentes isómeros de butilamino- o pentilaminocarbonilo. Ejemplos de "dialquilaminocarbonilo" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$. "Alquilamino(tiocarbonilo)" denota restos alquil amino de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{S})$. Ejemplos de "alquilamino(tiocarbonilo)" incluyen $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{S})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{S})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{S})$ -. "Dialquilamino(tiocarbonilo)" denota restos dialquilamino de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(=\text{S})$. Ejemplos de "dialquilamino(tiocarbonilo)" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{S})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{S})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{S})$ -. "Alcoxi(alquil)aminocarbonilo" denota restos alquilo y alcoxi de

cadena lineal o ramificada unidos a un átomo de nitrógeno de un resto aminocarbonilo. Ejemplos de "alcoxi(alquil)aminocarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{O}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHO}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$.

"Alquilsulfonilo" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfonilo. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$, y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. "Alquiltioalquilo" denota sustitución alquiltio en alquilo. Ejemplos de "alquiltioalquilo" incluyen CH_3SCH_2 , $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$. "Cianoalquilo" denota un grupo alquilo sustituido con un grupo ciano. Ejemplos de "cianoalquilo" incluyen NCCH_2 , NCCH_2CH_2 y $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2$. "Alquilamino" incluye un radical NH sustituido con alquilo de cadena lineal o ramificada. Ejemplos de "alquilamino" incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$. Ejemplos de "dialquilamino" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{N}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$. "Alquilaminoalquilo" denota sustitución alquilamino en alquilo. Ejemplos de "alquilaminoalquilo" incluyen CH_3NHCH_2 , $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2$. Ejemplos de "dialquilaminoalquilo" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$.

"Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "alquilcicloalquilo" denota la sustitución de alquilo en un resto cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, i-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" denota la sustitución de cicloalquilo en un resto de alquilo. Ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo, y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada. El término "cicloalcoxi" denota cicloalquilo unido a través de un átomo de oxígeno tal como ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. "Cicloalquenilo" incluye grupos tales como ciclopentenilo y ciclohexenilo así como grupos con más de un doble enlace tales como 1,3- y 1,4-ciclohexadienilo. "Cicloalquilcarbonilo" denota cicloalquilo unido a un grupo $\text{C}(=\text{O})$ incluyendo, por ejemplo, ciclopropilcarbonilo y ciclopentilcarbonilo. "Cicloalquilaminocarbonilo" denota cicloalquilamino unido a un grupo $\text{C}(=\text{O})$, por ejemplo, ciclopentilaminocarbonilo y ciclohexilaminocarbonilo. El término "cicloalcoxycarbonilo" significa cicloalcoxi unido a un grupo $\text{C}(=\text{O})$, por ejemplo, ciclopropiloxycarbonilo y ciclopentiloxycarbonilo.

El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen $\text{F}_3\text{C}-$, ClCH_2- , CF_3CH_2- y CF_3CCl_2- . Los términos "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio", "halodialquilaminoalquilo", "halotrialquilsililo", "haloalquenilo", "haloalquinilo", y similares, se definen de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Ejemplos de "haloalquiltio" incluyen $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$. Ejemplos de "haloalquilamino" incluyen $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{CHNH}$, $(\text{CF}_3)_2\text{CHNH}$ y $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{NH}$. Ejemplos de "halodialquilamino" incluyen $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{N}-$, $(\text{CF}_3)_2\text{N}-$ y $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)\text{N}-$. Ejemplos de "halodialquilaminoalquilo" incluyen $(\text{CF}_3)_2\text{NCH}_2-$, $(\text{CF}_3)_2\text{NC}(\text{CH}_3)\text{H}-$ y $(\text{CF}_3)(\text{CH}_3)\text{NCH}_2-$. Ejemplos de "halotrialquilsililo" incluyen $\text{CF}_3(\text{CH}_3)_2\text{Si}-$, $(\text{CF}_3)_3\text{Si}-$ y $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)_2\text{Si}-$. Ejemplos de "haloalquenilo" incluyen $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$. Ejemplos de "haloalquinilo" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ y $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$.

"Trialquilsililo" incluye tres radicales alquilo de cadena ramificada y/o lineal unidos a, y a través de un átomo de silicio tal como trimetilsililo, trietilsililo y t-butildimetilsililo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente está indicado por el prefijo " C_i-C_j " en el que i y j son números de 1 a 10. Por ejemplo, alquilsulfonilo C_1-C_4 indica de metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxi alquilo C_2 designa CH_3OCH_2- ; alcoxi alquilo C_3 designa, por ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$; y alcoxi alquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituidos con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, incluyendo los ejemplos $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que tiene un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede ser mayor de 1, dichos sustituyentes (cuando superan 1) se seleccionan de forma independiente del grupo de sustituyentes definidos (por ejemplo, $\text{CR}^{15a}\text{R}^{15b}$)_m donde m es 0, 1 o 2, y $\text{S}(=\text{O})_p(\text{NR}^4)_q$ donde p y q son independientemente 0, 1 o 2, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2). Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^{9a} , R^{9b} , R^{10} , R^{12} , R^{11a} , R^{11b} , R^{13a} , R^{13b} , R^{14a} , R^{14b} , R^{15a} o R^{15b} , entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que este es equivalente a dicho grupo que no está sustituido. Cuando se muestra que un grupo variable está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo $(\text{R}^v)_r$ en U-40 del Cuadro 1 en el que r puede ser 0, entonces hidrógeno puede estar en la posición incluso si no se indica en la definición del grupo variable. Cuando una o más posiciones en un grupo se dice que "no están sustituidas" o están "no sustituidas", entonces átomos de hidrógeno están unidos para completar todas las valencias libres.

Tal como se usa en el presente documento, los términos "alquilato" y "alquilado" se refieren a una reacción química en la que un grupo lábil es desplazado por un nucleófilo desde un radical que contiene carbono unido a través de un átomo de carbono al grupo lábil. A no ser que se indique de otro modo, el radical que contiene carbono no está limitado a alquilo; el radical que contiene carbono puede ser, por ejemplo, piridinilo, presente en los compuestos de bromopiridina de Fórmula 18 (véase más adelante).

A no ser que se indique de otro modo, un "anillo" o "sistema de anillo" como componente de la Fórmula 1 (por ejemplo, Y, J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} y R¹⁶) es carbocíclico o heterocíclico. El término "sistema de anillos" denota dos o más anillos que comparten átomos comunes. Como se comprende de forma general, el término "sistema de anillos bicíclico" denota un sistema de anillos que contiene dos anillos que comparten dos o más átomos comunes. Si los átomos comunes son adyacentes (es decir, hay un enlace entre los carbonos de puente), el sistema de anillos bicíclico es un "sistema de anillos bicíclico condensado". El término "sistema de anillos bicíclico heteroaromático" denota un sistema de anillos que consiste en dos anillos condensados, en los cuales, cualquiera o ambos anillos pueden ser aromáticos, y que contiene al menos un heteroátomo (por ejemplo, O, N) en al menos uno de los anillos que lo forman. El término "miembro de anillo" se refiere a un átomo u otro resto (por ejemplo, C(=O), C(=S), S(O) o S(O)₂) que forma la estructura de un anillo o sistema de anillos.

Los términos "anillo carbocíclico", "carbociclo" o "sistema de anillos carbocíclico" denotan un anillo o sistema de anillos en los que los átomos que forman la estructura del anillo se seleccionan solo de carbono. A no ser que se indique de otro modo, un anillo carbocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. Cuando un anillo carbocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces se denomina también "anillo aromático". "Carbocíclico saturado" se refiere a un anillo que tiene una estructura que consiste en átomos de carbono unidos entre sí por enlaces sencillos; a no ser que se indique de otro modo, las valencias de carbono que quedan están ocupadas por átomos de hidrógeno.

Los términos "anillo heterocíclico", "heterociclo" o "sistema de anillos heterocíclico" denotan un anillo o sistema de anillos en los que al menos un átomo que forma la estructura del anillo no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente, un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique otra cosa, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces se denomina también como "anillo heteroaromático" o "anillo heterocíclico aromático". Un anillo heterocíclico que no satisface la regla de Hückel se describe como un "anillo heterocíclico no aromático".

"Aromático" indica que cada uno de los átomos del anillo está básicamente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y en el que $(4n + 2)$ electrones π , donde n es un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con la regla de Hückel. El término "sistema de anillos aromático" denota un sistema de anillos carbocíclico o heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. El término "sistema de anillos carbocíclico aromático" denota un sistema de anillos carbocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. El término "sistema de anillos heterocíclico aromático" denota un sistema de anillos heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. Como se sobreentiende de forma general, el término "anillo saturado" denota un anillo en el que ningún miembro de anillo está unido a un miembro de anillo adyacente a través de un doble enlace. De forma análoga, el término "sistema de anillos saturado" denota un sistema de anillos en el que ningún miembro de anillo está unido a un miembro de anillo adyacente a través de un doble enlace.

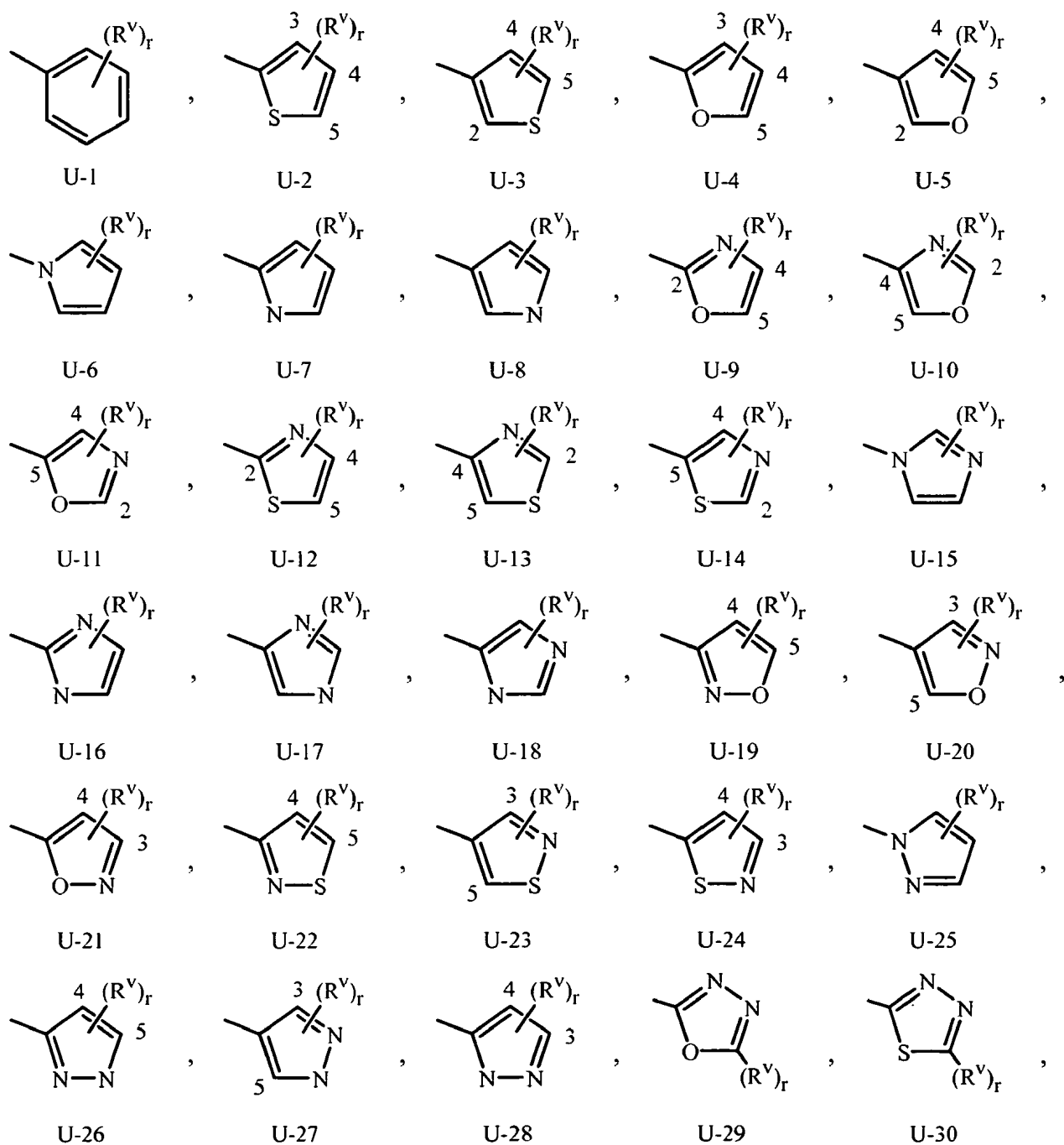
El término "opcionalmente sustituido" significa no sustituido o sustituido. Por tanto, un grupo opcionalmente sustituido (es decir, un radical), no está sustituido o tiene al menos un sustituyente no hidrógeno. A no ser que se indique un límite particular, un grupo puede estar sustituido con tantos sustituyentes opcionales como pueda acomodar reemplazando un átomo de hidrógeno por un sustituyente no hidrógeno o cualquier átomo de carbono o nitrógeno disponible en el grupo. Cuando el término "opcionalmente sustituido" está acompañado por un límite tal como para los grupos enumerados para J y R¹⁶, el número de sustituyentes opcionales no puede superar el límite incluso si otras posiciones están disponibles para sustitución. Por tanto, por ejemplo, la expresión "opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes" significa que puede estar presente ningún sustituyente, puede estar presente 1 sustituyente o pueden estar presentes hasta 5 sustituyentes si se acomodan por el número de posiciones disponibles para sustitución.

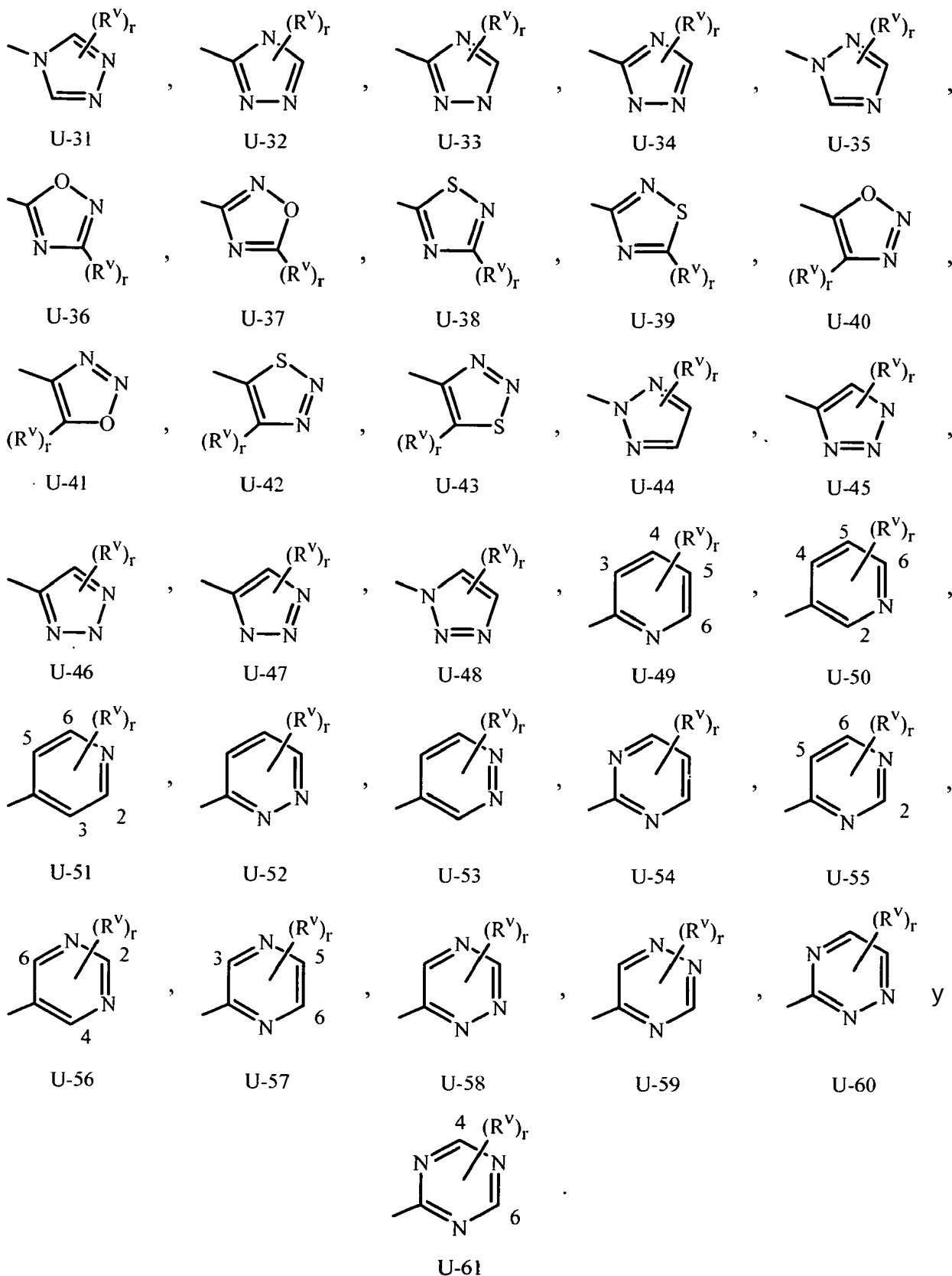
Como se ha indicado antes, J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} o R¹⁶ pueden ser (entre otros) fenilo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes que se definen en el Compendio de la invención. Un ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con hasta cinco sustituyentes es el anillo ilustrado como U-1 en el Cuadro 1, en el que R^V se selecciona de un grupo de sustituyentes que se definen en el Compendio de la invención para J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} o R¹⁶ (es decir, R⁷ y R¹⁷) y r es un número entero de 0 a 5.

Como se ha indicado antes, J o R¹⁶ pueden ser (entre otros) naftalenilo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes (seleccionados de forma independiente de R⁷ o R¹⁷). Como es bien conocido en la técnica, el sistema de anillos naftalenilo consiste en dos anillos fenilo condensados juntos en átomos de carbono adyacentes. El anillo naftalenilo unido al resto de la Fórmula 1 tiene 3 posiciones disponibles para sustituyentes R⁷ y R¹⁷, y el otro anillo naftalenilo tiene 4 posiciones disponibles para sustituyentes R⁷ y R¹⁷.

Como se ha indicado antes, J, R^{13a} , R^{13b} , R^{14a} , R^{14b} o R^{16} pueden ser (entre otros) un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes que se define en el Compendio de la invención. Ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con de uno a cinco sustituyentes incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en el Cuadro 1 en los que R^v es un sustituyente cualquiera que se define en el Compendio de la invención para J, R^{13a} , R^{13b} , R^{14a} , R^{14b} o R^{16} (por ejemplo, R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno) y r es un número entero de 0 a 5, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Puesto que U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 tienen únicamente una posición disponible, r, para estos grupos U, está limitado a los números enteros 0 o 1, y si r es 0 significa que el grupo U no está sustituido y está presente un hidrógeno en la posición indicada por $(R^v)_r$.

Cuadro 1



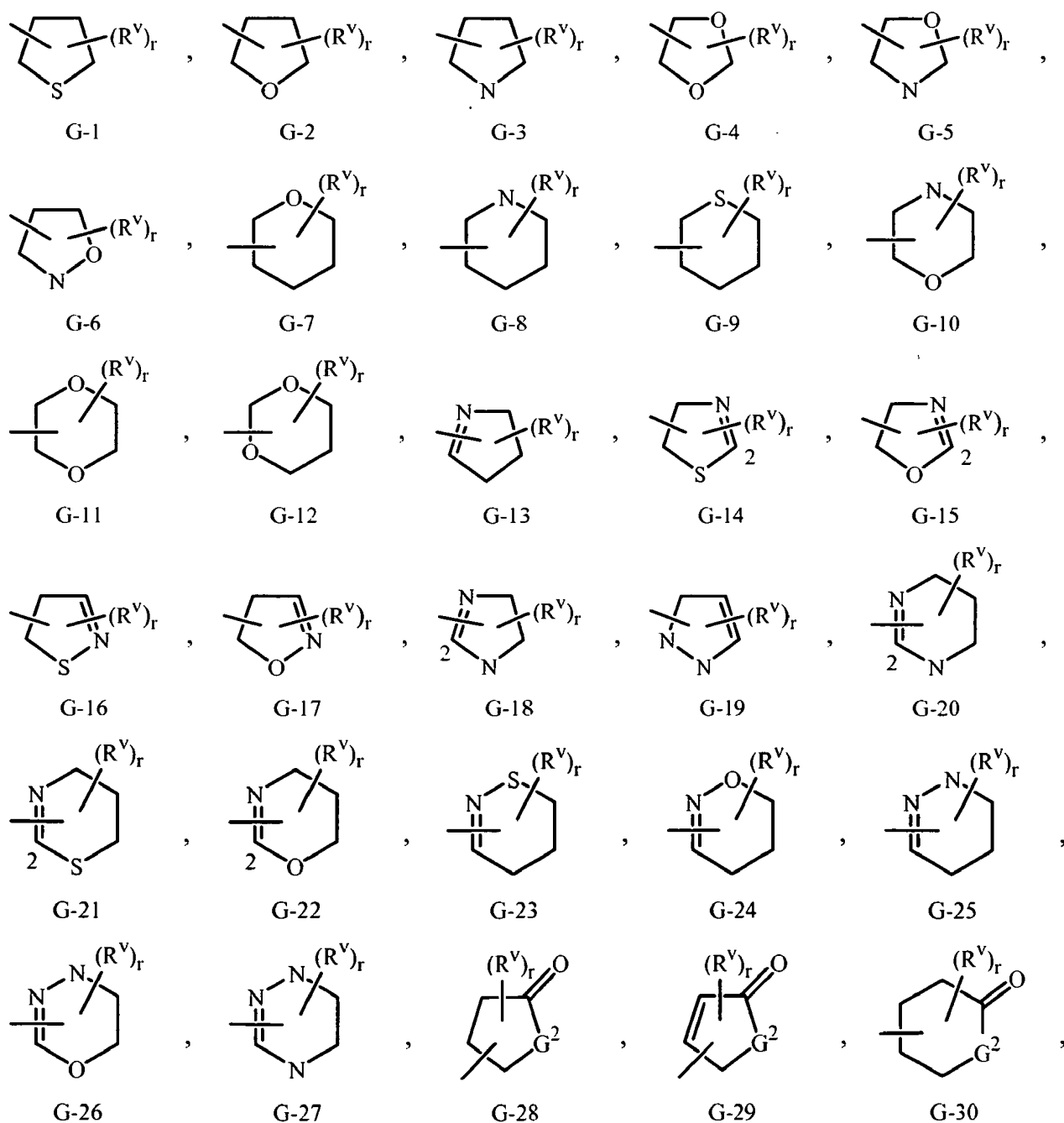


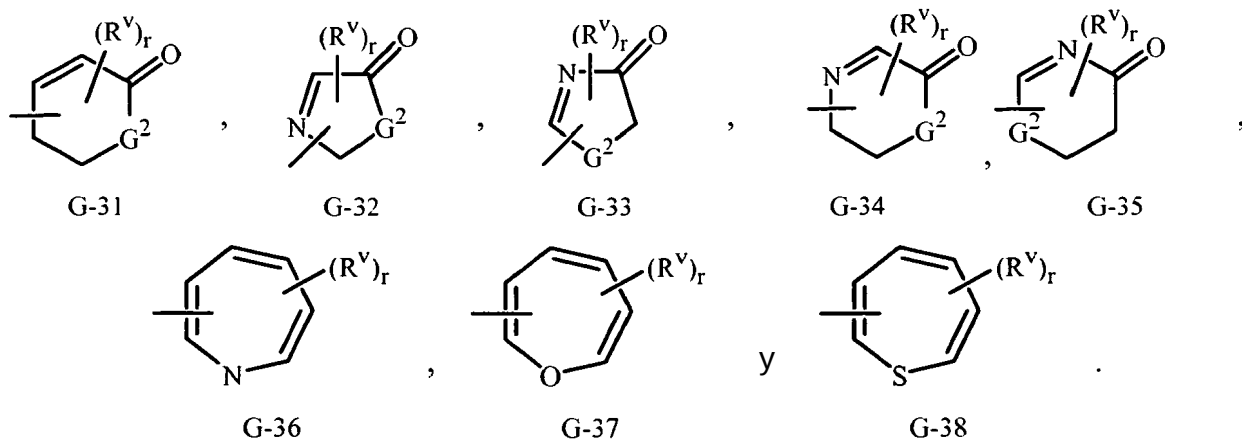
Cabe reseñar que cuando J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} o R¹⁶ es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros o un anillo heterocíclico no aromático; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo de sustituyentes que se define en el Compendio de la invención para J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} o R¹⁶, uno o dos miembros de anillo carbono del heterociclo pueden estar opcionalmente en la forma oxidada de un resto carbonilo.

Ejemplos de anillos heterocíclicos no aromáticos de 5 o 6 miembros incluyen los anillos G-1 a G-38 que se ilustran en el Cuadro 2. Nótese que cuando el punto de unión en el grupo G se ilustra como flotante, el grupo G puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo G por sustitución de un átomo de hidrógeno. Los sustituyentes opcionales que corresponden a R^v pueden estar unidos a cualquier carbono o nitrógeno disponible reemplazando a un átomo de hidrógeno. Para estos anillos G, r es de forma típica un número entero de 0 a 5, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo G.

Cabe reseñar que cuando J, R^{13a} , R^{13b} , R^{14a} , R^{14b} o R^{16} comprenden un anillo seleccionado de G-28 a G-35, G^2 se selecciona de O, S o N. Cabe resañar que cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por sustitución con H o los sustituyentes que corresponden a R^v como se define en el Compendio de la invención para J, R^{13a} , R^{13b} , R^{14a} , R^{14b} o R^{16} .

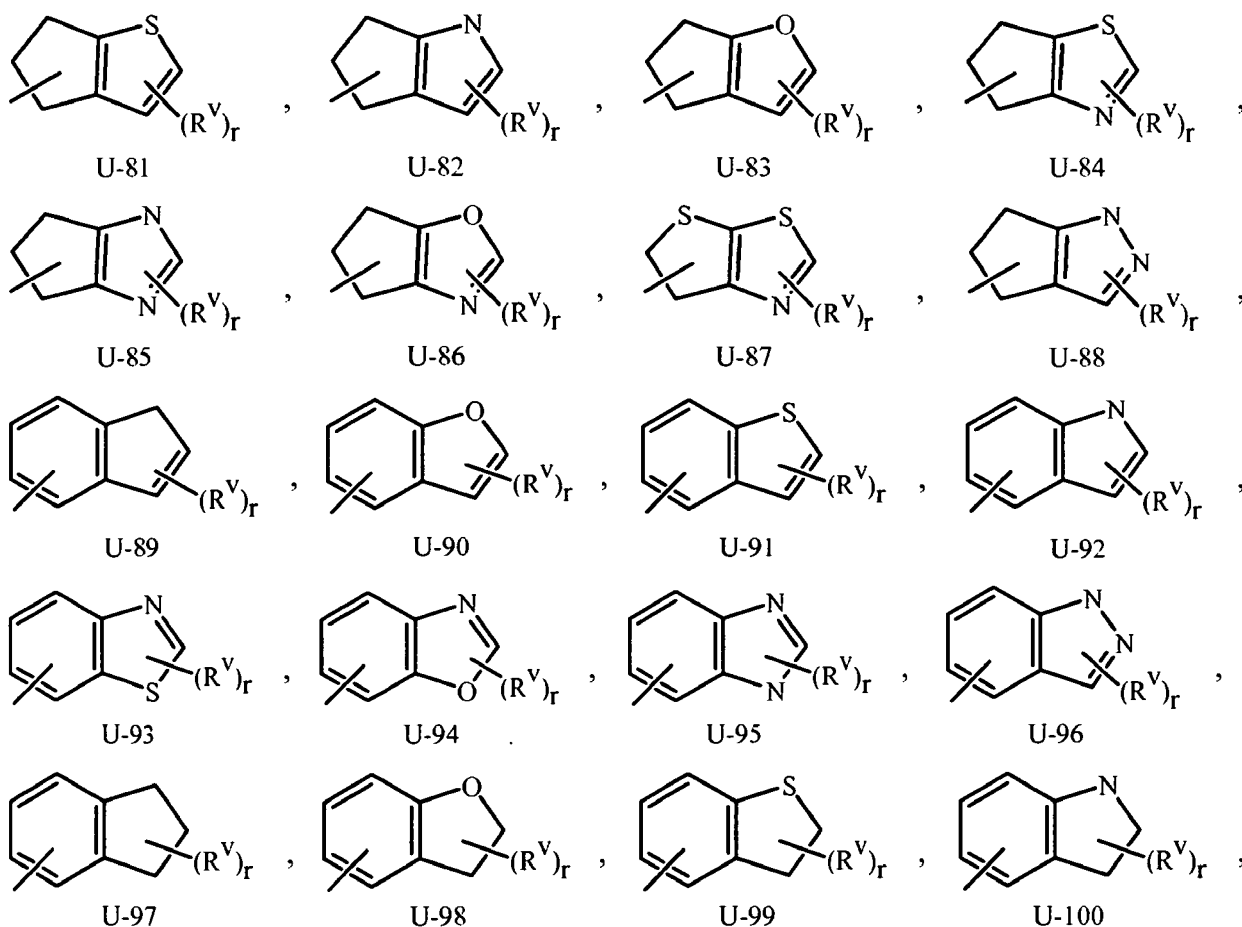
Cuadro 2

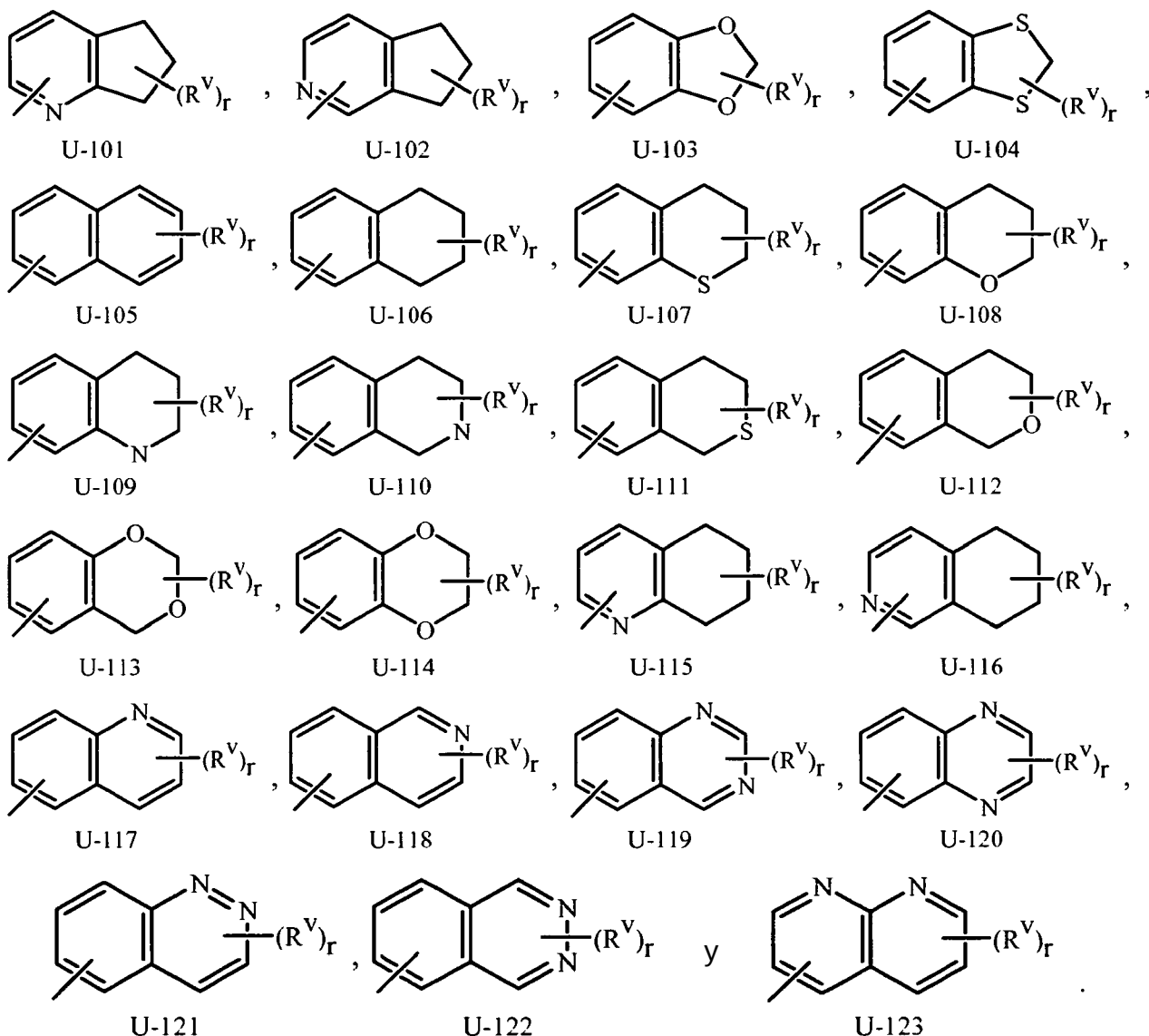




Como se ha indicado antes, J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} o R¹⁶ pueden ser (entre otros) un sistema bicíclico de anillos heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes que se define en el Compendio de la invención (es decir R⁷ o R¹⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno). Ejemplos de sistema bicíclico de anillos heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes incluyen los anillos U-81 a U-123 ilustrados en el Cuadro 3 en los que R^V es cualquier sustituyente que se define en el Compendio de la invención para J, R^{13a}, R^{13b}, R^{14a}, R^{14b} o R¹⁶ (es decir, R⁷ o R¹⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno), y r es de forma típica un número entero de 0 a 5.

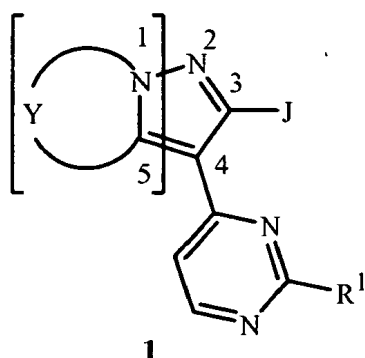
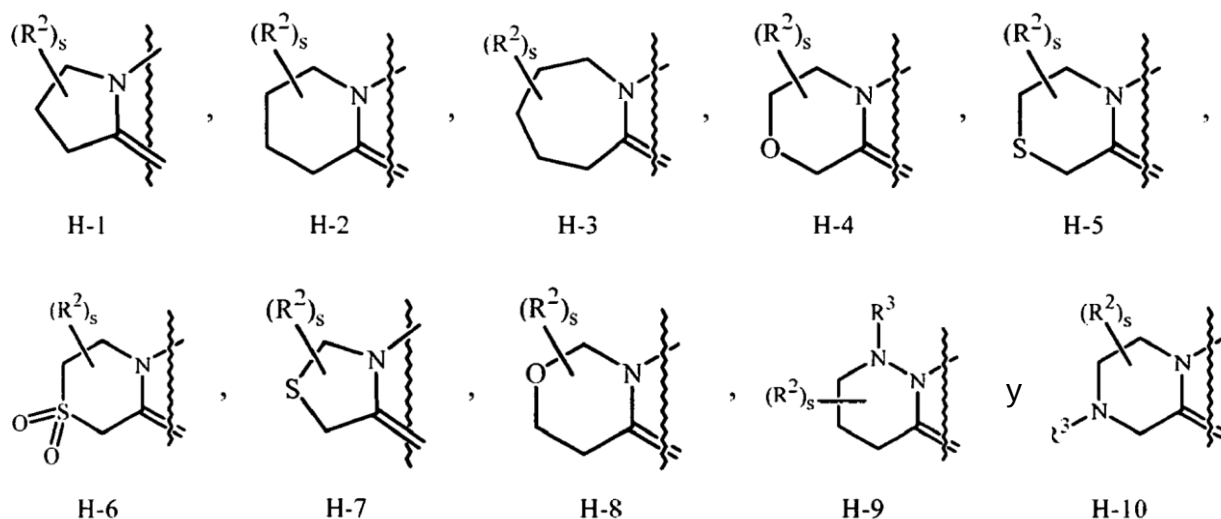
Cuadro 3





Aunque los grupos R^V se muestran en las estructuras U-1 a U-123 y G-1 a G-38, se apreciará que no es necesario que estos estén presentes puesto que son sustituyentes opcionales. Cabe reseñar que cuando R^V es H cuando está unido a un átomo, este es el mismo que si dicho átomo no está sustituido. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para completar su valencia están sustituidos con H o R^V . Cabe reseñar que cuando el punto de unión entre $(R^V)_r$ y el grupo U o G se ilustra como flotante, $(R^V)_r$ puede estar unido a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo U o G. Cabe reseñar que cuando el punto de unión en el grupo U o G está ilustrado como flotante, el grupo U o G puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U o G que reemplace a un átomo de hidrógeno. Cabe reseñar que algunos de los grupos U o G solo pueden estar sustituidos con menos de 4 grupos R^V (por ejemplo, U-2 a U-5, U-7 a U-48, U-52 a U-61, G-32 y G-33).

Como se ha indicado antes, Y junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos a los que está unido forma un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros que incluye miembros de anillo que se definen en el Compendio de la invención. Ejemplos de anillos condensados formados por Y incluyen los anillos ilustrados como H-1 a H-10 en el Cuadro 4. De forma típica, s es un número entero de 0 a 4. R^2 puede estar unido a cualquier carbono disponible del anillo formado por Y. Los átomos de nitrógeno que requieren un sustituyente para completar su valencia están sustituidos con R^3 . H-1 a H-10 del Cuadro 4 ilustran la porción de la Fórmula 1 enmarcada entre corchetes que contiene los anillos condensados formados por Y.

**Cuadro 4**

- 5 Se conocen en la técnica una amplia diversidad de procedimientos de síntesis que permiten la preparación de anillos y sistemas de anillos aromáticos y no aromáticos; para revisiones extensas véase el conjunto de ocho volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.
- 10 Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al otro(s) estereoisómero(s) o cuando se separa del otro(s) estereoisómero(s). Además, el experto sabe como separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva dichos estereoisómeros. Los compuestos de la invención
- 15 pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos, ya que el nitrógeno requiere un par de electrones disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá que los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica también

20 reconocerá que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Procedimientos de síntesis para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son bien conocidos por un experto en la técnica, incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiacidos tales como ácido peracético y *m*-cloroperbenzoico (MCPBA o ácido 3-cloroperbenzoico), peróxido de hidrógeno, hidropéroxidos de alquilo tales como hidropéroxido de *t*-butilo, perborato sódico y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos procedimientos para la preparación de *N*-óxidos se

25 han descrito y revisado exhaustivamente en la bibliografía, véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist en Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, páginas 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik en Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, páginas 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 43, páginas 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik en Advance in Heterocyclic Chemistry, vol. 9, páginas 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 22, páginas 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

30

Un experto en la técnica sabe que debido a que en el medioambiente y bajo condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus correspondientes formas no salinas, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Así, son útiles una amplia diversidad de sales de los compuestos de Fórmula 1 para controlar enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de plantas (es decir, son adecuadas desde el punto de vista agrícola). Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluensulfónico o valérico. Cuando un compuesto de Fórmula 1 contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales incluyen además las formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoniaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. Por consiguiente, la presente invención comprende los compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos y sales de los mismos adecuadas desde el punto de vista agrícola.

Los compuestos de Fórmula 1 y Fórmula 1a existen de forma típica en más de una forma, y la Fórmula 1 y la Fórmula 1a incluyen así todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que representan. Formas no cristalinas incluyen realizaciones que son sólidos tales como ceras y gomas, así como realizaciones que son líquidos como soluciones y productos fundidos. Formas cristalinas incluyen realizaciones que representan esencialmente un tipo de cristal sencillo y realizaciones que representan una mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, estos también se pueden diferenciar en la composición debido a la presencia o ausencia de agua u otras moléculas cocrystalizadas, que pueden estar unidas de forma fuerte o débil a la red. Los polimorfos pueden diferenciarse en dichas propiedades químicas, físicas y biológicas como la forma, densidad, dureza, color, estabilidad química, punto de fusión, carácter higroscópico, capacidad de suspensión, velocidad de disolución y disponibilidad biológica del cristal. Un experto en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto de Fórmula 1 y Fórmula 1a puede presentar efectos beneficiosos (por ejemplo, idoneidad para la preparación de formulaciones útiles, comportamiento biológico mejorado) con respecto a otro polimorfo o a una mezcla de polimorfos del mismo compuesto de Fórmula 1 y Fórmula 1a. La preparación y aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto de Fórmula 1 y Fórmula 1a se puede conseguir por procedimientos conocidos por los expertos en la técnica incluyendo, por ejemplo, cristalización usando disolventes y temperaturas seleccionados.

Realizaciones de la presente invención que se describen en el Compendio de la invención incluyen las descritas a continuación. En las siguientes realizaciones, la Fórmula I incluye *N*-óxidos y sales del mismo, y la referencia a "un compuesto de Fórmula 1" incluye las definiciones de sustituyentes especificados en el Compendio de la invención a no ser que se defina en las realizaciones.

Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en el que Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos (que se identifican con "1" y "5" respectivamente) formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $C(=O)$, $C(=S)$ y $S(=O)_p(NR^4)_q$.

Realización 1a. Un compuesto de Fórmula I o Realización 1 en el que Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros seleccionado del grupo que consiste en H-1, H-2, H-3, H-4, H-5, H-6, H-7, H-8, H-9 y H-10 representados en el Cuadro 4 en los que s es un número entero de 0 a 4.

Realización 2. Un compuesto de la Realización 1 en el que Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S y NR^3 .

Realización 3. Un compuesto de la Realización 2 en el que Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$ y O.

Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 3 en el que cada R^2 es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, $-CHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHR^{6a}$, alquilo C_1-C_5 , alqueno C_2-C_5 , alquino C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalqueno C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 , haloalcoxi C_1-C_5 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alqueno C_2-C_5 , haloalqueno C_3-C_5 , alquino C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 , alquiltio C_1-C_5 , haloalquiltio C_1-C_5 o cicloalquiltio C_3-C_6 .

Realización 5. Un compuesto de la Realización 4 en el que cada R^2 es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, $-CHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHR^{6a}$, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalcoxi C_3-C_6 o alquilcarbonilo C_2-C_5 .

Realización 6. Un compuesto de la Realización 5 en el que cada R^2 es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxi, -CHO, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 .

Realización 7. Un compuesto de la Realización 6 en el que R^2 es H.

5 Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 7 en el que R^3 es independientemente H, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -CHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 , haloalquilcarbonilo C_2-C_5 , cicloalquilcarbonilo C_4-C_7 , alcoxicarbonilo C_2-C_6 , haloalcoxicarbonilo C_2-C_6 , cicloalcoxicarbonilo C_4-C_7 , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_6 , alcoxialcoxicarbonilo C_3-C_6 , (alquiltio)carbonilo C_2-C_6 , alcoxi(tiocarbonilo) C_2-C_6 , alquil(tiocarbonilo) C_2-C_6 , alquiltio(tiocarbonilo) C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_7 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 , alquilamino(tiocarbonilo) C_2-C_6 , dialquilamino(tiocarbonilo) C_3-C_6 o alcoxi(alquil)aminocarbonilo C_3-C_6 .

Realización 9. Un compuesto de la Realización 8 en el que R^3 es independientemente H, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -CHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, alquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , haloalquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxicarbonilo C_2-C_4 o haloalcoxicarbonilo C_2-C_4 .

15 Realización 10. Un compuesto de la Realización 9 en el que R^3 es independientemente H, -C(=O)NH₂, -CHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, alquilcarbonilo C_2-C_3 o alcoxicarbonilo C_2-C_3 .

Realización 11. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 10 en el que R^6 es independientemente H o alquilo C_1-C_3 .

Realización 12. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 11 en el que R^{6a} es independientemente alquilo C_1-C_3 .

20 Realización 13. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 12 en el que J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos naftalenilo, o un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O) o C(=S), cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno.

Realización 14. Un compuesto de la Realización 13 en el que J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros; cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno.

30 Realización 14a. Un compuesto de la Realización 14 en el que J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno.

Realización 15. Un compuesto de la Realización 14a en el que J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 .

35 Realización 16. Un compuesto de la Realización 15 en el que J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado independientemente de R^7 .

Realización 17. Un compuesto de la Realización 16 en el que J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de F y CH₃.

40 Realización 18. Un compuesto de Fórmula 1 o la Realización 13 en el que J es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O) o C(=S), y opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno.

Realización 19. Un compuesto de la Realización 18 en el que J es un anillo carbocíclico no aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 .

45 Realización 20. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 19 en el que cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , haloalquilo C_1-C_6 , ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi $C_{1\mu}-C_6$, alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 .

Realización 21. Un compuesto de la Realización 20 en el que cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 .

50 Realización 22. Un compuesto de la Realización 21 en el que cada R^7 es independientemente halógeno o alquilo C_1-C_3 .

Realización 23. Un compuesto de la Realización 22 en el que cada R^7 es independientemente F o CH_3 .

Realización 24. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 23 en el que R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$, $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$ o $-OR^{12}$.

Realización 24a. Un compuesto de la Realización 24 en el que R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$ o $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$.

5 Realización 25. Un compuesto de la Realización 24a en el que R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$.

Realización 26. Un compuesto de la Realización 24a en el que R^1 es $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$.

Realización 27. Un compuesto de la Realización 24 en el que R^1 es $-OR^{12}$.

10 Realización 28. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 27 en el que cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalqueno C_2-C_{10} , haloalquino C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialqueno C_3-C_{10} , alcoxialquino C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

15 Realización 29. Un compuesto de la Realización 28 en el que cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

Realización 30. Un compuesto de la Realización 29 en el que cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente alquilo C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

20 Realización 31. Un compuesto de la Realización 30 en el que cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente isopropilo o ciclopropilo.

Realización 32. Un compuesto de la Realización 31 en el que cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente isopropilo.

Realización 33. Un compuesto de la Realización 31 en el que cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente ciclopropilo.

25 Realización 34. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 33 en el que cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

Realización 34a. Un compuesto de la Realización 34 en el que cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

Realización 35. Un compuesto de la Realización 34 en el que cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H o alquilo C_1-C_6 .

30 Realización 36. Un compuesto de la Realización 35 en el que cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H.

35 Realización 37. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 27 en el que cuando cada pareja de R^{9a} y R^{9b} , o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros, dicho anillo incluye opcionalmente miembros seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, NR^3 o $S(=O)_p(NR^4)_q$ y está opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, $-CN$, alquilo C_1-C_2 y alcoxi C_1-C_2 .

Realización 38. Un compuesto de la Realización 37 en el que cuando cada pareja de R^{9a} y R^{9b} , o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 5 miembros, dicho anillo está opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, $-CN$ y alquilo C_1-C_2 .

40 Realización 39. Un compuesto de la Realización 38 en el que cuando cada pareja de R^{9a} y R^{9b} , o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 5 miembros, dicho anillo está opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 .

45 Realización 40. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 39 en el que R^{12} es H, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalqueno C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

Realización 41. Un compuesto de la Realización 40 en el que R^{12} es alquilo C_1-C_3 o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$.

Realización 42. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 41 en el que cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H, halógeno o alquilo C_1-C_5 .

Realización 43. Un compuesto de la Realización 42 en el que cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H o halógeno.

Realización 44. Un compuesto de la Realización 43 en el que cada R^{15a} y R^{15b} es H.

Realización 45. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 41 en el que una pareja de R^{15a} y R^{15b} se toma junto con el átomo de carbono al que están unido formando $-C(=O)-$ o un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 .

Realización 46. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 41 en el que una pareja de R^{15a} y R^{15b} unidos a átomos de carbono adyacentes se toma junto con los átomos de carbono a los que está unida formando un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 .

Realización 47. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 46 en el que cada R^{16} es independientemente fenilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalqueno C_3-C_8 , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno.

Realización 48. Un compuesto de la Realización 47 en el que cada R^{16} es independientemente cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalqueno C_3-C_8 , fenilo o naftalenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} .

Realización 49. Un compuesto de la Realización 48 en el que cada R^{16} es independientemente cicloalquilo C_3-C_8 o fenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} .

Realización 50. Un compuesto de la Realización 49 en el que cada R^{16} es independientemente cicloalquilo C_3-C_8 o fenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{17} .

Realización 51. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 50 en el que cada R^{17} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o ciano; o fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros.

Realización 52. Un compuesto de la Realización 51 en el que cada R^{17} es halógeno, alquilo C_1-C_6 o ciano.

Realización 53. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 52 en el que m es 0 o 1.

Realización 54. Un compuesto de la Realización 53 en el que m es 0.

Realización 55. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 23 en el que R^1 es $-N=CR^{13a}R^{13b}$ o $-NR^{10}N=CR^{14a}R^{14b}$.

Realización 56. Un compuesto de la Realización 55 en el que R^1 es $-N=CR^{13a}R^{13b}$.

Realización 57. Un compuesto de la Realización 55 en el que R^1 es $-NR^{10}N=CR^{14a}R^{14b}$.

Realización 58. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 57 en el que cada R^{13a} y R^{13b} es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalqueno C_3-C_8 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} o alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} .

Realización 59. Un compuesto de la Realización 58 en el que cada R^{13a} y R^{13b} son independientemente H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$ o alquilo C_1-C_6 .

Realización 60. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 57 en el que R^{13b} es H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$ o alquilo C_1-C_6 .

Realización 60a. Un compuesto de la Realización 60 en el que R^{13b} es H.

Realización 60b. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 57, o 60 o 60a en el que R^{13a} es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_3 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_3 .

Realización 61. Un compuesto de la Realización 60b en el que R^{13a} es independientemente un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros; cada anillo opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_3 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_3 .

Realización 62. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 57 en el que R^{13a} y R^{13b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo carbocíclico de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 , halógeno, -CN y alcoxi C_1-C_2 .

5 Realización 63. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 62 en el que cada R^{14a} y R^{14b} son independientemente H, -CN, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} o alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} .

10 Realización 64. Un compuesto de la Realización 63 en el que cada R^{14a} y R^{14b} es independientemente H, -CN, $-C(=O)OR^{18}$ o alquilo C_1-C_6 .

Realización 65. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 62 en el que R^{14b} es H, -CN, $-C(=O)OR^{18}$ o alquilo C_1-C_6 .

Realización 65a. Un compuesto de la Realización 65 en el que R^{14b} es H.

15 Realización 65b. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 62, o 65 o 65a en el que R^{14a} es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_3 , halógeno, -CN y alcoxi C_1-C_3 .

20 Realización 66. Un compuesto de la Realización 65b en el que R^{14a} es independientemente un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros; cada anillo opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_3 , halógeno, -CN y alcoxi C_1-C_3 .

25 Realización 67. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 62 en el que R^{14a} y R^{14b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo carbocíclico de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 , halógeno, -CN y alcoxi C_1-C_2 .

Realización 68. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 67 en el que cada R^{18} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 .

Realización 69. Un compuesto de la Realización 68 en el que cada R^{18} es independientemente alquilo C_1-C_3 o cicloalquilo C_1-C_3 .

30 Realización 70. Un compuesto de la Realización 69 en el que cada R^{18} es independientemente alquilo C_1-C_3 .

Realización 71. Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 69 en el que R^{10} es H, alquilo C_1-C_5 o haloalquilo C_1-C_5 .

Realización 72. Un compuesto de la Realización 71 en el que R^{10} es H o alquilo C_1-C_5 .

Realización 73. Un compuesto de la Realización 72 en el que R^{10} es H o metilo.

35 Realización 74. Un compuesto de Fórmula **1a** en el que R^{1a} es halógeno, $-SCH_3$, $-S(=O)_2CH_3$, $-OS(=O)_2CF_3$ o $-OS(=O)_2Ph-p-CH_3$.

Realización 75. Un compuesto de la Realización 74 en el que R^{1a} es halógeno o $-S(=O)_2CH_3$.

Realización 76. Un compuesto de la Realización 75 en el que R^{1a} es Cl o $-S(=O)_2CH_3$.

40 Realizaciones de esta invención, incluyendo las Realizaciones 1-76 anteriores, así como cualquier otra realización descrita en el presente documento, se puede combinar de cualquier forma, y las descripciones de variables en las realizaciones pertenecen no solo a los compuestos de las Fórmulas **1** y **1a** sino también a los compuestos de partida y a los compuestos intermedios (incluyendo la Fórmula **1a**) útiles para la preparación de compuestos de las Fórmulas **1** y **1a**. Además, las realizaciones de esta invención, incluyendo las realizaciones 1-76 anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente y cualquiera de sus combinaciones pertenecen a las composiciones y procedimientos de la presente invención.

Las combinaciones de las Realizaciones 1-76 se ilustran por:

Realización A1. Un compuesto de Fórmula **1** en el que

Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos (que están identificados con "1" y "5" respectivamente) formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los

		átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $C(=O)$, $C(=S)$, $-C=C-$ y $S(=O)_p(NR^4)_q$;
	cada R^2	es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, $-CHO$, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 ;
5	R^3	es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHCN$, $-CHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, alquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , haloalquilcarbonilo C_2-C_4 , alcóxicarbonilo C_2-C_4 o haloalcóxicarbonilo C_2-C_4 ;
10	J	es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos naftalenilo, o un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$ o $C(=S)$, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;
	cada R^7	es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 ;
	R^1	es $-NR^{9a}R^{9b}$, $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$ o $-OR^{12}$;
15	cada R^{9a}	y R^{11a} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alcóxialquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;
	cada R^{9b}	y R^{11b} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;
20	R^{12}	es H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;
	cada R^{15a} y R^{15b}	es independientemente H, halógeno o alquilo C_1-C_5 ;
25	cada R^{16}	es independientemente fenilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno; m es 0 o 1;
30	cada R^{17}	es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o ciano; o fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; y
	R^{10}	es H, alquilo C_1-C_5 o haloalquilo C_1-C_5 .
Realización A2. Un compuesto de la Realización A1 en el que		
35	Y	se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos (que están identificados con "1" y "5" respectivamente) formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S y NR^3 ;
40	R^3	es independientemente H, $-C(=O)NH_2$, $-CHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, alquilcarbonilo C_2-C_3 o alcóxicarbonilo C_2-C_3 ;
	J	es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;
45	cada R^7	es independientemente halógeno o alquilo C_1-C_3 ;
	R^1	es $-NR^{9a}R^{9b}$ o $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$;
	cada R^{9a} y R^{11a}	es independientemente alquilo C_1-C_6 , alcóxialquilo C_2-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;
	cada R^{9b} y R^{11b}	es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

m es 0;

cada R¹⁶ es independientemente cicloalquilo C₃-C₈ o fenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁷;

R¹⁷ es halógeno, alquilo C₁-C₆ o ciano; y

5 R¹⁰ es H o metilo.

Realización A3. Un compuesto de la Realización A2 en el que

R² es H;

J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷;

10 cada R⁷ es independientemente F o CH₃;

R¹ es -NR^{9a}R^{9b};

R^{9a} es independientemente isopropilo o ciclopropilo;

R^{9b} es independientemente H.

Realización A4. Un compuesto de la Realización A3 en el que

15 Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos (que están identificados con "1" y "5" respectivamente) formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos enlazantes nitrógeno y carbono, seleccionados del grupo que consiste en C(R²)₂ y O; y

J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de F y CH₃.

20 Realización B1. Un compuesto de Fórmula **1a** en el que

R^{1a} es halógeno o -S(=O)₂CH₃; y

J e Y se definen como antes para la Fórmula **1**.

Realización B2. Un compuesto de la Realización B1 en el que R^{1a} es Cl o -S(=O)₂CH₃. Realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmulas **1** y **1a** seleccionados del grupo que consiste en:

- 25 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-N-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 8),
N-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 109),
4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-N-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 107),
- 30 2-[[4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-2-pirimidinil]amino]-1-propanol (Compuesto 108),
2-[[4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[5,1-a]piridin-3-il]-2-pirimidinil]amino]-1-propanol (Compuesto 5),
N-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 12),
N-(1-metiletil)-4-(4,5,6,7-tetrahidro-2-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-2-pirimidinamina (Compuesto 26),
N-ciclopropil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-2-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-2-pirimidinamina (Compuesto 27),
- 35 (2S)-2-[[4-(4,5,6,7-tetrahidro-2-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-2-pirimidinil]amino]-1-propanol (Compuesto 54),
4-(6,7-dihidro-2-fenil-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il)-N-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 116),
N-ciclopropil-4-(6,7-dihidro-2-fenil-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il)-2-pirimidinamina (Compuesto 117),
N-ciclopropil-4-[6,7-dihidro-2-(3-tienil)-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 121),
2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina (Compuesto 174),
- 40 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina (Compuesto 150),

3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazina (Compuesto 145), y

2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metilsulfonyl)-4-pirimidinil]-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazina (Compuesto 178).

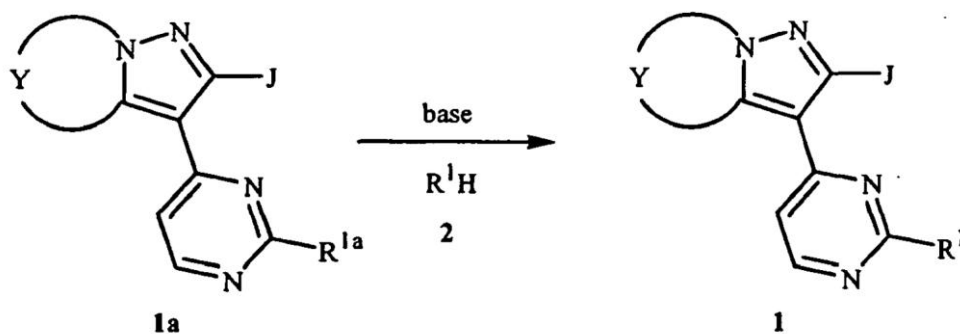
Cabe destacar las realizaciones anteriores, incluyendo las Realizaciones 1 a 76 y A1 a A4, en las que la Fórmula 1 no incluye *N*-óxidos y sales de los mismos.

- 5 Esta invención proporciona una composición fungicida que comprende un compuesto de Fórmula 1 (en el que R^1 puede ser H e incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales del mismo) y al menos otro fungicida. Cabe destacar como realizaciones de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto que corresponde a cualquiera de las realizaciones de compuestos descritas antes.
- 10 Esta invención proporciona una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales del mismo), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Cabe destacar como realizaciones de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto que corresponde a cualquiera de las realizaciones de compuestos descritas antes.
- 15 Esta invención proporciona un procedimiento para controlar enfermedades en plantas causadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o a una porción de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de Fórmula 1 (en el que R^1 puede ser H y incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales del mismo). Cabe destacar como realizaciones de tales procedimientos los procedimientos que comprenden aplicar una cantidad eficaz desde el
- 20 punto de vista fungicida de un compuesto que corresponde a cualquiera de las realizaciones de compuesto descritas antes. Cabe destacar particularmente son realizaciones en las que los compuestos se aplican como composiciones de la presente invención.

Para preparar los compuestos de las Fórmulas 1 y 1a se puede usar uno o más de los siguientes procedimientos y variaciones que se describen en los Esquemas 1-10. Las definiciones de R^1 , R^2 , R^{1a} , Y y J en los compuestos de las Fórmulas 1-22 siguientes son como se han definido antes en el Compendio de la invención a no ser que se indique de otro modo. Las Fórmulas 1b-1c son varios subgrupos de la Fórmula 1, y todos los sustituyentes par las Fórmulas 1b-1c son como se han definido antes para la Fórmula 1 a no ser que se indique de otro modo. La Fórmula 7a es un subgrupo de la Fórmula 7, y la Fórmula 11a es un subgrupo de la Fórmula 11.

Como se muestra en el Esquema 1, los compuestos de la Fórmula 1 en la que R^1 es distinto de H se pueden preparar por reacción de compuestos de Fórmula 1a en la que R^{1a} es un grupo saliente tal como halógeno, $-SCH_3$, $-S(=O)CH_3$, $-S(=O)_2CH_3$, $-OS(=O)_2CH_3$, $-OS(=O)_2CF_3$ o $-OS(=O)_2Ph$ -*p*- CH_3 como se define en el Compendio de la invención con compuestos de Fórmula 2 en la que R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$, $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$, $-OR^{12}$, $-N=CR^{13a}R^{13b}$ o $-NR^{10}N=CR^{14a}R^{14b}$. Esta reacción se puede llevar a cabo poniendo en contacto un compuesto de Fórmula 1a con un compuesto de Fórmula 2 en presencia de una base tal como un hidruro metálico, hidróxido de metal alcalino o carbonato de metal alcalino en presencia o no de un disolvente aprótico adecuado, tal como *N,N*-dimetilformamida, dimetilsulfóxido o acetonitrilo. De forma alternativa, la reacción se puede llevar a cabo en un exceso de compuestos de Fórmula 2 cuando $R^{1a}H$ es una amina primaria o secundaria o una anilina. En esta alternativa, sirve como base el exceso de amina primaria o secundaria o anilina. Esta reacción se lleva a cabo de forma típica a 0-175°C durante un período de tiempo de reacción de 1 a 48 h. Los compuestos de Fórmula 1 en la que R^1 es H se pueden preparar por la reacción de (resultado del contacto) compuestos de Fórmula 1a en la que R^{1a} es halógeno con hidrógeno gas en presencia de un catalizador tal como paladio sobre carbón activado o Ni Raney.

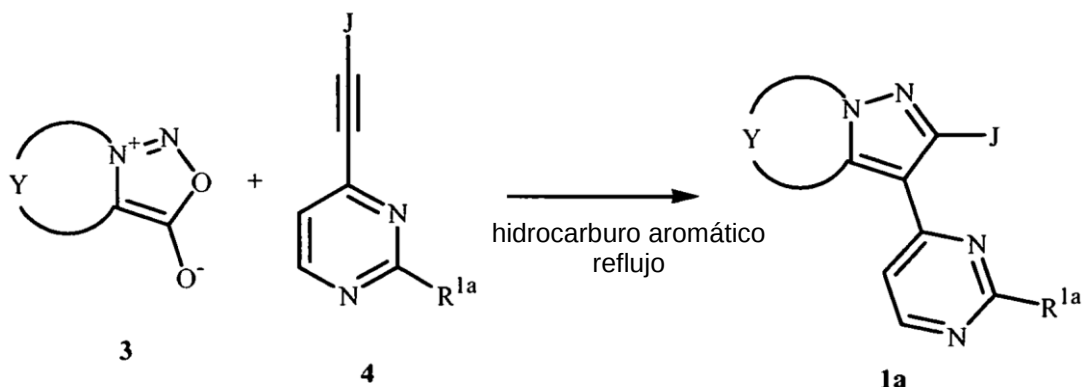
Esquema 1



El Esquema 2 describe la forma de preparar compuestos de Fórmula 1a mediante reacción de compuestos de Fórmula 3 con alquinos sustituidos de forma apropiada de Fórmula 4 a temperaturas que varían de forma típica de

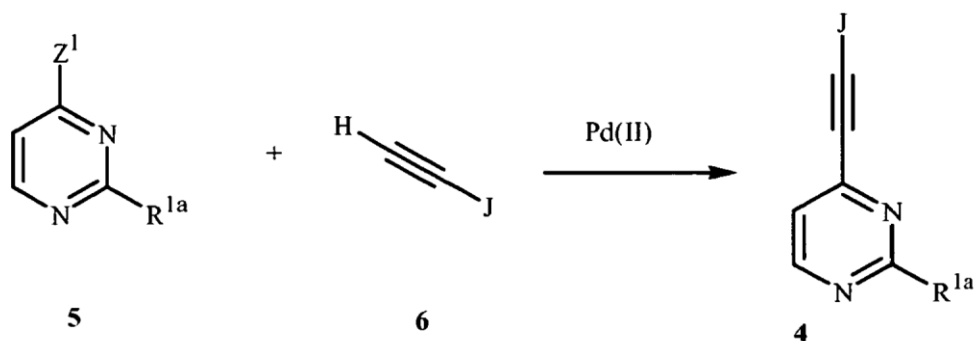
80 a 250°C con tiempos de reacción que varían de 24 a 96 h. Se puede emplear una diversidad de disolventes; disolventes particularmente útiles incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xilenos o mesitileno.

Esquema 2



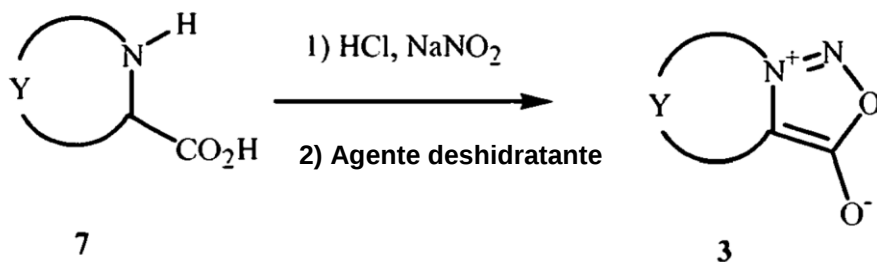
En el procedimiento del Esquema 3, se pueden acoplar pirimidinas disponibles de forma comercial de Fórmula 5 en la que Z^1 es Cl, Br o I y R^{1a} es Cl, $-SCH_3$, $-S(=O)CH_3$ o $-S(=O)_2CH_3$ con aril alquinos de Fórmula 6 en presencia de catalizadores que comprenden paladio(II) para obtener compuestos de Fórmula 4. Catalizadores y condiciones apropiados se describen por Heck, R. F. en *Palladium Reagents in Organic Synthesis*, Academic Press, Nueva York, 1985.

Esquema 3



En el Esquema 4, se preparan compuestos de Fórmula 3 a partir de aminoácidos de Fórmula 7 (en la que Y es H-1, H-2, H-5, H-7 y H-10 del Cuadro 4) tal como prolina, ácido pipecolínico, ácido tiomorfolin-3-carboxílico, ácido tiazolidin-4-carboxílico y ácido 4-N-BOC-piperazin-2-carboxílico, disponibles de forma comercial. Los aminoácidos descritos de Fórmula 7 se pueden nitrosar con nitrito sódico en ácido acuoso tal como ácido clorhídrico y, a continuación, tratar con agentes deshidratantes tales como anhídrido trifluoracético para preparar compuestos de Fórmula 3. Un procedimiento de deshidratación representativo se describe por Boyer, J. et al. en *Heterocycles* 1990, 31(3), 481-4 y Venkatesan, A.M. et al. en *J. Med. Chem.* 2006, 49, 4623-4637.

Esquema 4

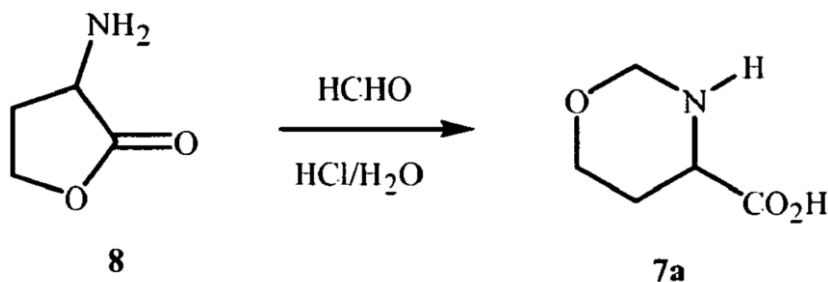


20

El aminoácido de Fórmula 7 en la que Y es H-4 del Cuadro 4 se puede preparar a partir de morfolina como se describe por Asher, V. et al. en Tetrahedron Lett. 1981, 22, 141-144.

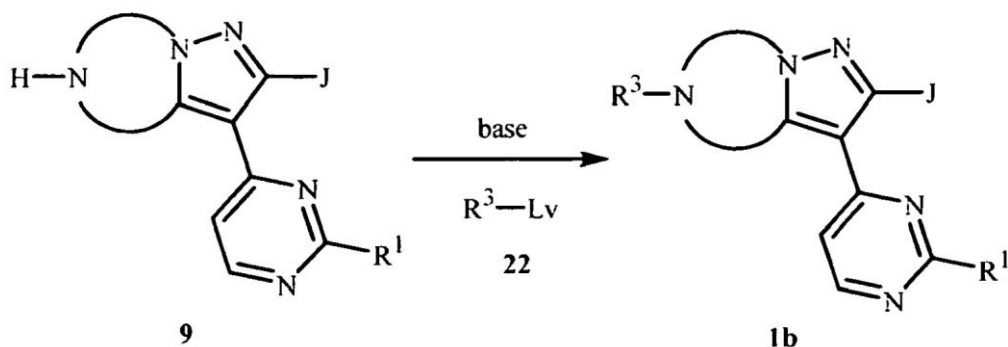
El procedimiento de síntesis del Esquema 5 es un procedimiento útil para la preparación de compuestos de Fórmula 7 en la que Y es H-8 del Cuadro 4. En el Esquema 5 se puede preparar un compuesto de Fórmula 7a, a partir de la lactona homoserina de Fórmula 8 disponible de forma comercial y una solución al 37 % de formaldehído en agua en presencia de una cantidad catalítica de ácido clorhídrico como se describe por Shiro, Y. et al. en Tetrahedron 2006, 62, 8687-8695.

Esquema 5



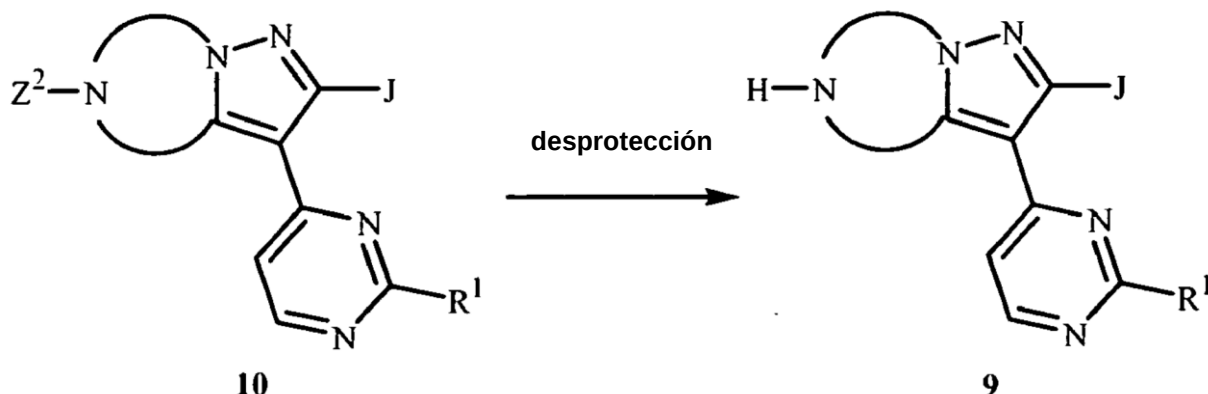
Se pueden preparar determinados compuestos de Fórmula 1b (Fórmula 1 en la que Y comprende NR^3 como un miembro de anillo y R^3 es alquilo o alquilcarbonilo como se define en el Compendio de la invención) por desplazamiento de un grupo saliente apropiado Lv unido a R^3 en la Fórmula 22 con el resto amina cíclico de un compuesto de Fórmula 9 en presencia de una base como se muestra en el Esquema 6. Bases adecuadas incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y *N,N*-diisopropiletilamina, y bases inorgánicas tales como carbonato potásico o carbonato sódico. La reacción se lleva a cabo en un disolvente orgánico aprótico tal como tetrahidrofurano, diclorometano, cloroformo, éter dietílico o *N,N*-dimetilformamida a temperaturas de 0 a 100°C con tiempos de reacción que varían de 1 a 72 horas. Grupos salientes adecuados (es decir, Lv) en los compuestos de Fórmula 22 incluyen bromo, yodo, mesilato ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CH}_3$), triflato ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) y similares.

Esquema 6



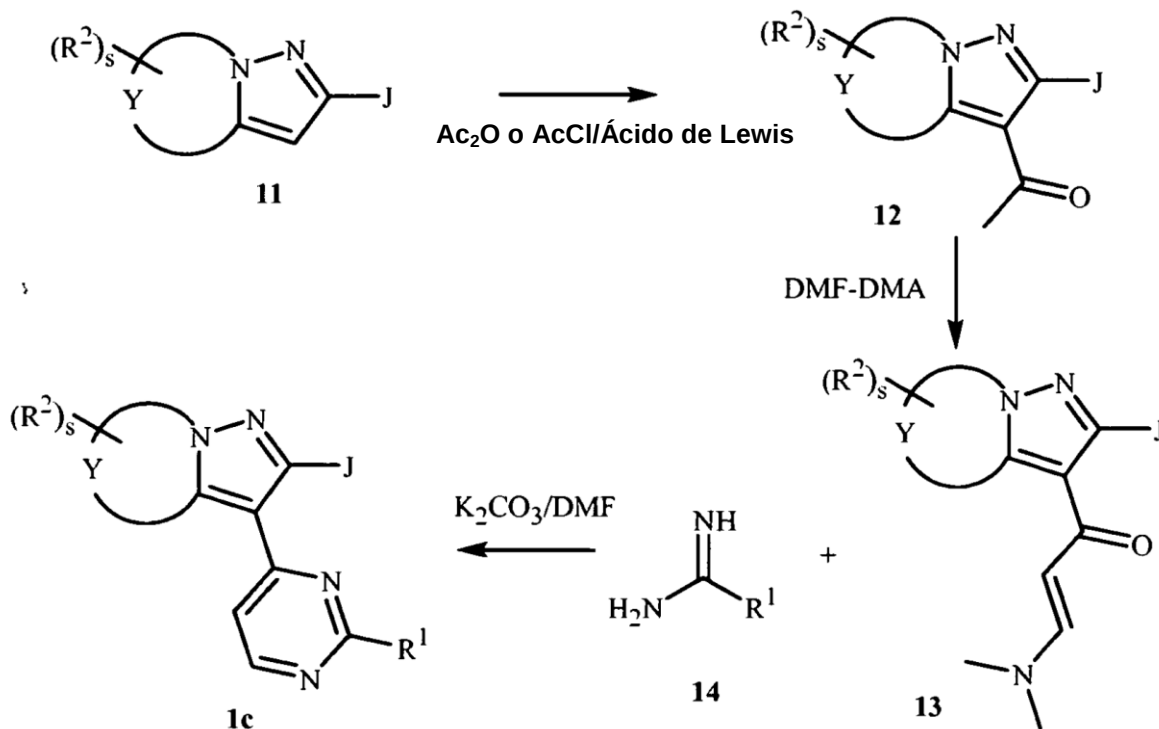
En el Esquema 7, la desprotección de compuestos de Fórmula 10, en la que Z^2 es un grupo protector tal como un grupo carbamoilo o bencilo, proporciona compuestos de Fórmula 9 por una serie de procedimientos conocidos por un experto en la técnica. Una visión general de esta técnica se describe por Greene, T. W. et al. en Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley-Interscience, Nueva York, 1999. Un experto en la técnica reconocerá que se pueden preparar muchos compuestos de Fórmula 10 por procedimientos análogos a los descritos en los Esquemas 1 a 4 anteriores en los que el anillo Y contiene N-Z^2 .

Esquema 7



Los compuestos de Fórmula **1c** en la que Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$ se pueden preparar como se muestra en el Esquema 8. La reacción de anhídrido acético o cloruro de acetilo con compuestos de Fórmula **11** en presencia de catalizadores ácidos de Lewis tales como cloruro de aluminio, BF_3 -eterato o cloruro de hierro(III) en disolventes tales como 1,2-dimetoxietano durante un período de tiempo de 1 a 18 horas a temperaturas de reacción de 0 a 165°C da compuestos de Fórmula **12**. Los productos de acilación de Fórmula **12** se hacen reaccionar con *N,N*-dimetilformamida dimetilacetal puro (DMF-DMA) a temperaturas de 50 a 150°C durante tiempos de reacción de 1 a 8 horas para proporcionar compuestos de Fórmula **13**. Los compuestos de Fórmula **1c** se pueden preparar a partir de los compuestos de Fórmula **13** por reacción con guanidinas de Fórmula **14**, en la que R^1 es como se describe en el Compendio de la invención, en disolventes tales como *N,N*-dimetilformamida, tetrahidrofurano o diclorometano en presencia de bases tales como K_2CO_3 , Na_2CO_3 , $KHCO_3$ o $NaHCO_3$ a temperaturas de 25 a 150°C.

Esquema 8

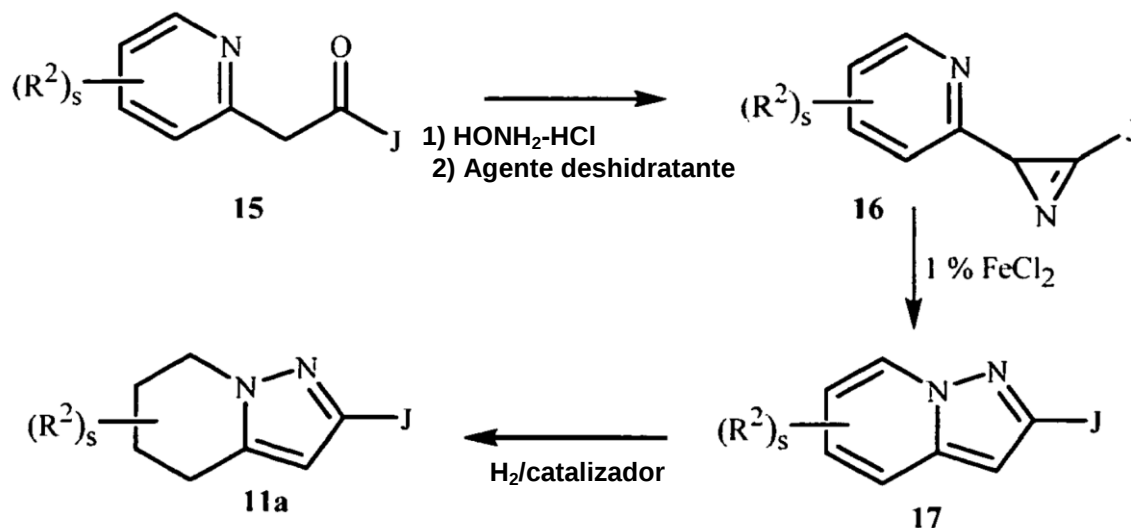


Los compuestos de Fórmula **11a** (es decir, la Fórmula **11** en la que s es 0 a 4) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 9. Los compuestos de Fórmula **15** se pueden hacer reaccionar con hidrócloruro de hidroxilamina, seguido por deshidratación/ciclación para dar compuestos de Fórmula **16** como se describe en Stevens, K. et al. Org. Lett., 2005, 21, 4753-56. Los compuestos de Fórmula **17** se pueden preparar calentando compuestos de Fórmula **16** en un disolvente tal como triclorobenceno de 50 a 250°C o tratando compuestos de Fórmula **16** en un disolvente tal como 1,2-dimetoxietano en presencia de una cantidad catalítica de cloruro de hierro(II) de 0 a 150°C.

como se describe en Johns, B. et al. Tetrahedron 2003, 59, 9001-9011. Los compuestos de Fórmula **11a** se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de Fórmula **17** con hidrógeno gas en presencia de un catalizador tal como paladio sobre carbón activado en disolventes alcohólicos tales como metanol o etanol como se describe en Elsner, J. et al. J. Med. Chem. 2005, 48, 5771-5779.

5

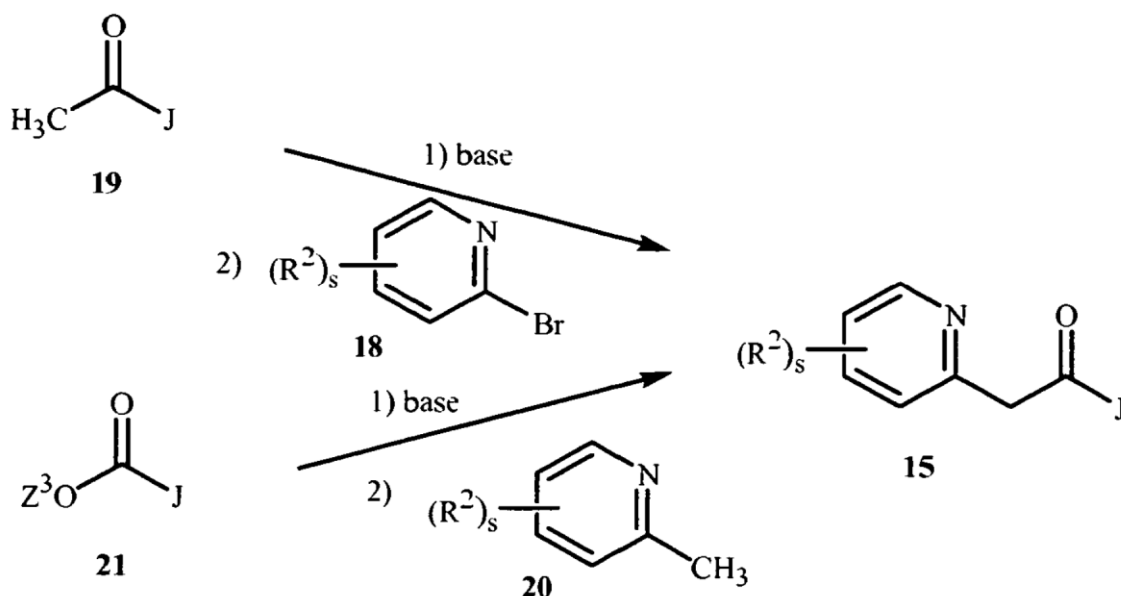
Esquema 9



Los compuestos de Fórmula **15** se pueden preparar por dos procedimientos mostrados en el Esquema 10. Se pueden desprotonar acetofenonas sustituidas disponibles de forma comercial de Fórmula **19** con una base tal como bis(trimetilsilil)amida de litio o diisopropilamida de litio y, a continuación, alquilar con una bromopiridina sustituida de forma apropiada de Fórmula **18**. De forma alternativa, los compuestos de Fórmula **15** se pueden preparar también por desprotonación de metilpiridinas sustituidas de Fórmula **20** por bases tales como hidruro sódico, bis(trimetilsilil)amida de litio o diisopropilamida de litio en disolventes tales como tetrahidrofurano o dioxano a temperaturas de -50 a 80°C, seguido por tratamiento con compuestos éster disponibles de forma comercial de Fórmula **21** en la que Z³ es metilo o etilo para proporcionar los compuestos de Fórmula **15**.

15

Esquema 10



Se reconoce que algunos reaccionantes y condiciones de reacción descritos antes para la preparación de los compuestos de Fórmulas **1** y **1a** pueden no ser compatibles con determinadas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará a obtener los productos deseados. El uso y elección de los grupos protectores será evidente para un experto en la síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2ª ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que,

20

en ciertos casos, después de introducir un reaccionante dado como se representa en cualquiera de los esquemas individuales, puede ser necesario llevar a cabo otras etapas de síntesis de rutina no descritas con detalle para completar la síntesis de los compuestos de Fórmulas **1** y **1a**. Un experto en la técnica también reconocerá que puede ser necesario llevar a cabo una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al que se sobreentiende por la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmulas **1** y **1a**.

Un experto en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmulas **1** y **1a** y los intermedios descritos en el presente documento se pueden someter a diversas reacciones de sustitución electrófila, nucleófila, radicalica, organometálica, de oxidación y reducción para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

Sin elaboración adicional, se cree que el experto en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención hasta su alcance más completo. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos pretenden ser únicamente ilustrativos y no limitantes de la descripción de ningún modo. Las etapas en los siguientes Ejemplos ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética global, y el material de partida para cada etapa puede no haber sido preparado necesariamente por una ejecución de preparación particular cuyo procedimiento se describe en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes están en peso excepto para los de disolventes cromatográficos o cuando se indique de otro modo. Las partes y porcentajes para las mezclas de disolventes cromatográficos están en volumen a menos que se indique de otro modo. Los espectros de RMN de ^1H se presentan en ppm de campo bajo el del tetrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa doblete, "t" significa triplete, "q" significa cuádruplete, "m" significa multiplete, "dd" significa doblete de dobletes, "dt" significa doblete de tripletes, "s ancho" significa singlete ancho.

Ejemplo 1

Preparación de 2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina (Compuesto 174) y *N*-(ciclopropilmetil)-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 24)

Etapas A: Preparación de 4-[2-(4-fluorofenil)etilil]-2-(metiltio)pirimidina

Se añadieron 4-yodo-2-(metiltio)pirimidina (35,7 g, 142 mmol) y 1-etinil-4-fluorobenceno (17,0 g, 142 mmol) a trietilamina (200 ml) a temperatura ambiente. A la solución resultante se añadieron diclorobis(trifenilfosfina)paladio(II) (1,0 g, 1,4 mmol) y yoduro de cobre (1,0 g, 5,2 mmol). A continuación la mezcla de reacción se agitó bajo una atmósfera de nitrógeno a temperatura ambiente durante 18 h. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para eliminar el exceso de trietilamina. El residuo se repartió entre agua (400 ml) y diclorometano (400 ml). La fase orgánica se lavó con agua (2 x 400 ml) y se secó (MgSO_4) y el disolvente se evaporó a presión reducida dando un aceite. La purificación por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice con acetato de etilo/hexanos de 0 a 50% como eluyente dio 18,3 g del compuesto del epígrafe como un sólido marrón claro. RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,5 (d, 1H), 7,6 (m, 2H), 7,08 (m, 3H), 2,58 (s, 3H).

Etapas B: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metiltio)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina

Se agitó a 165 °C durante 18 horas una suspensión de tetrahidropirido[c]sidnona (5,57 g, 38,7 mmol) (preparada de acuerdo con el procedimiento de Heterocycles 1990, 31(3), 481-4) y 4-[2-(4-fluorofenil)etilil]-2-(metiltio)pirimidina (es decir, el producto de la Etapa A) (9,44 g, 38,7 mmol) en mesitileno (100 ml). El disolvente se evaporó a presión reducida dando un aceite. Este residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (0:1 a 2:4) dando 6,0 g del compuesto del epígrafe como un sólido beige.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,2 (d, 1H), 7,4 (m, 2H), 7,0 (m, 2H), 6,6 (d, 1H), 4,2 (t, 2H), 3,16 (t, 2H), 2,5 (s, 3H), 2,1 (m, 2H), 1,95 (m, 2H).

Etapas C: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina

Una mezcla de 2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metiltio)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina (es decir, el producto de la Etapa B) (6,0 g, 17,6 mmol) y ácido 3-cloroperbenzoico (70 %, 7,77 g, 35,2 mmol) disuelto en cloroformo (125 ml) se agitó a 25°C durante 18 h. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (20,0 g). La mezcla de reacción se concentró a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (1:9 a 2:3) como eluyente dando 6,0 g del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido amarillo.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,5 (d, 1H), 7,4 (m, 2H), 7,09 (m, 3H), 4,24 (t, 2H), 3,3 (s, 3H), 3,24 (t, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).

Etapas D: Preparación de *N*-(ciclopropilmetil)-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinamina

Una mezcla de 2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina (es decir, el producto de la Etapa C) (200 mg, 0,54 mmol) y ciclopropilmetilamina (2,46 g, 34,6 mmol) se agitó a 85°C durante 18 h. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (20,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró entonces a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (1:9 a 2:3) como eluyente dando 97 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanquecino.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,05 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,04 (t, 2H), 6,24 (d, 1H), 5,31 (m, 1H), 4,22 (t, 2H), 3,23 (t, 2H), 3,11 (t, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,06 (m, 1H), 0,51 (m, 2H), 0,23 (m, 2H).

10 Ejemplo 2

Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina (Compuesto 150), *N*-ciclobutil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 51), 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 8) y *N*-[4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinil]acetamida (Compuesto 52)

15 Etapa A: Preparación de 2-cloro-4-[2-(4-fluorofenil)etiril]pirimidina

Se añadieron 2,4-dicloropirimidina (50,0 g, 333 mmol) y 1-etiril-4-fluorobenceno (40,0 g, 333 mmol) a trietilamina (200 ml) a 25°C. A la mezcla de reacción se añadieron diclorobis(trifenilfosfina)paladio(II) (1,0 g, 1,4 mmol) y yoduro de cobre (1,0 g, 5,2 mmol). La mezcla de reacción se agitó bajo una atmósfera de nitrógeno a temperatura ambiente durante 18 h. El residuo se repartió entre agua (400 ml) y diclorometano (400 ml). La fase orgánica se lavó con agua (2 x 400 ml), se secó (MgSO_4) y se evaporó a presión reducida dando un aceite. La purificación por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice con acetato de etilo de 0 a 50%/hexanos como eluyente dio 69,5 g del compuesto del epígrafe como un sólido marrón claro.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,63 (d, 1H), 7,62 (m, 2H), 7,4 (d, 1H), 7,11 (t, 2H).

Etapa B: Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina

Una suspensión de tetrahidropirido[c]sidnona (18,6 g, 129 mmol) (preparada de acuerdo con el procedimiento de Heterocycles 1990, 31(3), 481-4) y 2-cloro-4-[2-(4-fluorofenil)etiril]pirimidina (es decir, el producto de la Etapa A) (30,0 g, 129 mmol) en 300 ml de mesitileno se agitó a 165°C durante 18 h. La mezcla de reacción se evaporó a presión reducida dando un aceite. Este residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (0:1 a 2:4) dando 28,0 g del compuesto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido beige.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,26 (d, 1H), 7,43 (m, 2H), 7,10 (m, 2H), 6,82 (d, 1H), 4,23 (t, 2H), 3,20 (t, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,96 (m, 2H).

Etapa C: Preparación de *N*-ciclobutil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinamina

Una mezcla de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina (es decir, el producto de la Etapa B) (200 mg, 0,54 mmol), trietilamina (55 mg, 0,54 mmol) y ciclobutilamina (5,0 ml) se agitó a 65°C durante 18 h. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (20,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (1:9 a 1:0) como eluyente dando 70 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,26 (d, 1H), 7,43 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 6,82 (d, 1H), 5,27 (d, 1H), 4,41 (m, 1H), 4,21 (t, 2H), 3,11 (t, 2H), 2,36 (m, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,92 (m, 4H), 1,72 (m, 2H).

Etapa D: Preparación de 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-*N*-1-metiletil-2-pirimidinamina

Una mezcla de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina (es decir, el producto de la Etapa B) (200 mg, 0,54 mmol) e isopropilamina (5,0 ml) se agitó a 34°C durante 18 h. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (20,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (1:9 a 1:0) como eluyente dando 115 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanquecino.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,05 (d, 1H), 7,43 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 6,21 (d, 1H), 4,99 (d, 1H), 4,21 (t, 2H), 4,05 (m, 1H), 3,11 (t, 2H), 2,10 (m, 2H), 1,95 (m, 2H), 1,23 (d, 6H).

Etapa E: Preparación de *N*-[4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinil]acetamida

Una mezcla de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina (es decir, el producto de la Etapa B) (0,10 g, 0,27 mmol), acetamida (0,08 g, 1,3 mmol), tamices moleculares (4 Å, 3,0 g) en 4 ml de *N,N*-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió hidruro sódico (dispersión al 55%, 0,06 g, 1,3 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a 100°C durante la noche. La mezcla de reacción se filtró entonces a través de una almohadilla de auxiliar de filtrado de tierra de diatomeas Celite®, y luego se concentró a presión reducida. El aceite bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión sobre gel de sílice usando 0-100% de acetato de etilo en hexanos como eluyente dando 55 mg del compuesto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un aceite.

RMN de ¹H (CDCl₃) δ 8,31 (d, 1H), 8,04 (s ancho, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,67 (d, 1H), 4,26 (m, 2H), 3,17 (m, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).

Ejemplo 3

Preparación de 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 141) y 2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-3-[2-[(1-metiletil)amino]-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]pirazin-5(4*H*)-carboxilato de metilo (Compuesto 138)

Etapa A: Preparación de hidrógeno 4-nitroso-1,3-piperazincarboxilato de 1-(fenilmetilo)

A una solución de hidrógeno 1,3-piperazindicarboxilato de 1-(fenilmetilo) (5,0 g, 18,9 mmol) en ácido clorhídrico 1 N (50 ml) a 0°C se añadió nitrito sódico (2,5 g, 36,2 mmol). La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 3 h, y luego se dejó calentar hasta 25°C. La mezcla de reacción se repartió entre agua (400 ml) y diclorometano (400 ml). La fase orgánica se lavó con agua (2 x 400 ml), se secó (MgSO₄) y se evaporó a presión reducida dando 5,7 g del compuesto del epígrafe como un aceite viscoso. Este compuesto se usó sin purificación o caracterización posterior.

Etapa B: Preparación de sal interna de 4,5,6,7-tetrahidro-3-hidroxi-5-[(fenilmetoxi)carbonil][1,2,3]oxadiazolo[3,4-a]pirazin-8-io

Se trató una solución de hidrógeno 4-nitroso-1,3-piperazindicarboxilato de 1-(fenilmetilo) (es decir, el producto de la Etapa A) (5,7 g, 19 mmol) con anhídrido del ácido trifluoracético (4,89 g, 23,3 mmol) a 0°C. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 2 h y, a continuación, se dejó calentar hasta 25°C mientras continuaba la agitación durante 1 h. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, y el residuo se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (5,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (1:1 a 1:0) como eluyente dando 3,0 g del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo.

RMN de ¹H (CDCl₃) δ 7,37 (m, 5H), 5,20 (s, 2H), 4,59 (s, 2H), 4,32 (m, 2H), 4,03 (m, 2H).

Etapa C: Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazin-5(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo

Una mezcla de 2-cloro-4-[2-(4-fluorofenil)etil]pirimidina (es decir, el producto del Ejemplo 2, Etapa A) (2,51 g, 10,8 mmol) y sal interna de 4,5,6,7-tetrahidro-3-hidroxi-5-[(fenilmetoxi)carbonil][1,2,3]oxadiazolo[3,4-a]pirazin-8-io (es decir, el producto de la Etapa B) (3,00 g, 10,8 mmol) en mesitileno (100 ml) se agitó a 165°C durante 18 h. La mezcla de reacción se enfrió y se concentró a presión reducida. El residuo se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (10,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (0:1 a 1:1) como eluyente dando 1,5 g del compuesto del epígrafe como un aceite blanco.

RMN de ¹H (CDCl₃) δ 8,26 (d, 1H), 7,4 (m, 7H), 7,14 (t, 2H), 6,85 (d, 1H), 5,24 (s ancho, 2H), 5,17 (m, 2H), 4,29 (m, 2H), 4,05 (t, 2H).

Etapa D: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-3-[2-[(1-metiletil)amino]-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]pirazin-5(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo

Una solución de isopropilamina (2,0 ml) y 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazin-5(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto de la Etapa C) (1,00 g, 2,05 mmol) se calentó en un tubo herméticamente cerrado a 80°C en un reactor de microondas durante 8 h. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para eliminar el exceso de amina. El residuo se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (10,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (0:1 a 7:1) como eluyente dando 0,5 g del compuesto del epígrafe como un sólido blanco.

RMN de ¹H (DMSO-*d*₆) δ 7,99 (s ancho, 1H), 7,47 (dd, 2H), 7,37 (m, 5H), 7,09 (t, 2H), 6,18 (d, 1H), 5,13 (s, 2H), 5,21 (s, 2H), 4,9 (m, 1H), 4,27 (m, 2H), 4,04 (m, 2H), 1,21 (m, 6H).

Etapa E: Preparación de 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina

Se añadieron paladio (10 % sobre carbón activado, 25 mg) y cloruro de hidrógeno 2 M en metanol (20 ml) a una solución de 2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-3-[2-[(1-metiletil)amino]-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-*a*]pirazin-5(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto de la Etapa D) (0,50 g, 0,14 mmol) en metanol (30 ml). La suspensión resultante se agitó en un aparato de Parr bajo hidrógeno gas (68,9 kPa) durante 18 h. La suspensión resultante se filtró y se concentró hasta sequedad dando 0,42 g del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 9,35 (s, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,65 (dd, 2H), 7,27 (t, 2H), 5,02 (s, 1H), 4,72 (s, 1H), 4,49 (s, 2H), 4,43 (t, 2H), 4,01 (s, 2H), 3,44 (m, 1H), 1,22 (d, 3H), 1,07 (d, 3H).

Etapa F: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-3-[2-[(1-metiletil)amino]-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-*a*]pirazin-5(4*H*)-carboxilato de metilo

Se añadió trietilamina (96 mg, 0,948 mmol) a una solución de 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*a*]pirazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (es decir, el producto de la Etapa E) (0,150 g, 0,426 mmol) y cloroformiato de metilo (41,1 μl , 0,178 mmol) en tetrahidrofurano (40 ml). La mezcla de reacción se agitó a 25°C durante 24 h. La mezcla resultante se concentró a presión reducida. El residuo se diluyó con diclorometano (50 ml) y se trató con gel de sílice (10,0 g). La suspensión de gel de sílice se concentró a presión reducida dando una mezcla de gel de sílice y producto bruto, que se purificó por cromatografía sobre gel de sílice usando un gradiente de acetato de etilo/hexanos (0:1 a 1:4) como eluyente dando 25 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanquecino.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,00 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 6,19 (d, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,98 (d, 1H), 4,27 (m, 2H), 4,19 (m, 1H), 4,02 (m, 2H), 3,79 (s, 3H), 1,28 (d, 6H).

Ejemplo 4

Preparación de *N*-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 131) y 1-[3-[2-(ciclopropilamino)-4-pirimidinil]-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-il]jetanona (Compuesto 134)

Etapa A: Preparación de hidrógeno tetrahydro-2-nitrosopiridazin-1,(3*S*)(2*H*)-dicarboxilato de 1-(fenilmetilo)

Se añadió gota a gota durante 10 minutos una solución de nitrito sódico (1,03 g, 15,0 mmol) en 8 ml de agua a una suspensión de hidrógeno tetrahydro-2-nitrosopiridazin-1,(3*S*)(2*H*)-dicarboxilato de 1-(fenilmetilo) (2,64 g, 10,0 mmol; preparado como se describe en Coats et al. J. Org. Chem. 2004, 69, 1734) en ácido clorhídrico 1 N (30 ml) a 4°C. Después de 3,5 h la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo (40 ml), y se separaron las fases. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (2 X 20 ml), y las fases orgánicas reunidas se secaron sobre sulfato sódico, se filtraron y se concentraron a presión reducida dando 3,14 g del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo. Este compuesto se usó sin purificación o caracterización posterior.

Etapa B: Preparación de sal interna de 4,5,6,7-tetrahydro-3-hidroxi-7-[(fenilmetoxi)carbonil][1,2,3]oxadiazolo[3,4-*b*]piridazin-8-io

Se trató una solución de hidrógeno tetrahydro-2-nitrosopiridazin-1,(3*S*)(2*H*)-dicarboxilato de 1-(fenilmetilo) bruto (es decir, el producto de la Etapa A) (3,14 g, 10,0 mmol) en éter dietílico (80 ml) a 2°C con anhídrido del ácido trifluoroacético (2,52 g, 12,0 mmol). Después de 30 minutos se observó un precipitado. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 3 h y luego se filtró. El precipitado se aclaró con hexanos dando 2,23 g del compuesto del epígrafe como un sólido blanco.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 7,37 (m, 5H), 5,32 (s, 2H), 3,99 (m, 2H), 2,79 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).

Etapa C: Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo

Se agitó a 140°C durante 4 h una mezcla de la sidnona, sal interna de 4,5,6,7-tetrahydro-3-hidroxi-7-[(fenilmetoxi)carbonil][1,2,3]oxadiazolo[3,4-*b*]piridazin-8-io (es decir, el producto de la Etapa B) (1,54 g, 5,59 mmol) y 4-[2-(4-fluorofenil)etnil]-2-(metiltio)pirimidina (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa A) (1,0 g, 4,30 mmol) en mesitileno (10 ml). La mezcla de reacción se enfrió y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 5 a 40% en hexanos como eluyente dando 0,9 g del compuesto del epígrafe como un sólido amarillo.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,29 (d, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,34 (m, 5H), 7,11 (m, 2H), 6,86 (d, 1H), 5,28 (s, 2H), 4,01 (m, 2H), 3,34 (m, 2H), 2,05 (m, 2H).

Etapa D: Preparación de 3-[2-(ciclopropilamino)-4-pirimidinil]-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo

Se calentó una solución del 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto de la Etapa C) (464 mg, 1,0 mmol) y ciclopropilamina (1,3 ml, 18,5 mmol) en cloroformo (3 ml) a 120°C en un tubo herméticamente cerrado bajo irradiación por microondas durante 1 hora y luego a 160°C durante 5 minutos. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con diclorometano.

- 5 Las fases orgánicas reunidas se secaron sobre sulfato sódico, se filtraron y se concentraron a presión reducida. El residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 20 a 100% en hexanos como eluyente dando 240 mg del compuesto del epígrafe como un sólido.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,09 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,33 (m, 5H), 7,07 (m, 2H), 6,30 (d, 1H), 5,28 (m, 2H), 5,25 (s, 1H), 3,99 (m, 2H), 3,31 (m, 2H), 2,76 (m, 1H), 2,00 (m, 2H), 0,78 (m, 2H), 0,56 (m, 2H).

- 10 Etapa E: Preparación de *N*-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinamina

Se burbujeó nitrógeno gas a través de una solución de 3-[2-(ciclopropilamino)-4-pirimidinil]-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto de la Etapa D) (150 mg, 0,31 mmol) en metanol (5 ml) durante 5 minutos. A la mezcla de reacción se añadió paladio al 10 % sobre carbón activado (150 mg, 100 % en peso), y la mezcla resultante se agitó bajo hidrógeno (100 kPa) a temperatura ambiente durante 2 h. La mezcla de reacción se filtró entonces a través de una almohadilla de auxiliar de filtrado de tierra de diatomeas Celite®, y el catalizador se aclaró con metanol y se filtró. Los filtrados reunidos se concentraron y el residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando isopropanol al 0-25 % en diclorometano como eluyente dando 92 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanquecino.

- 20 RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,08 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,30 (d, 1H), 5,29 (m, 2H), 3,49 (m, 2H), 3,28 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 1,98 (m, 2H), 0,79 (m, 2H), 0,56 (m, 2H).

Etapa F: Preparación de 1-[3-[2-(ciclopropilamino)-4-pirimidinil]-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-il]etanona

- 25 Una cantidad catalítica de 4-dimetilaminopiridina (aproximadamente 5 mg) se añadió a una solución de *N*-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinamina (es decir, el producto de la Etapa E) (42,1 mg, 0,12 mmol) y anhídrido acético (0,023 ml, 0,24 mmol) en 2 ml de piridina a temperatura ambiente. Después de 3 h la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (3 × 10 ml). La fase orgánica reunida se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida. El residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 20 a 100% en hexanos como eluyente dando 25 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

30 RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,13 (d, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,31 (d, 1H), 5,30 (s, 1H), 4,02 (m, 2H), 3,29 (s, 2H), 2,78 (m, 1H), 2,27 (s, 3H), 2,07 (m, 2H), 0,81 (m, 2H), 0,58 (m, 2H).

Ejemplo 5

- 35 Preparación de 2-[[4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinil]amino]-1-propanol (Compuesto 132)

Etapa A: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidro-3-[2-[(2-hidroxi-1-metiletil)amino]-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo

- 40 Se calentó una solución de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto del Ejemplo 4, Etapa C) (390 mg, 0,84 mmol) y *DL*-2-amino-1-propanol (2,62 ml, 3,36 mmol) en cloroformo (3 ml) a 120°C en un tubo herméticamente cerrado bajo irradiación de microondas durante 1 h. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, y el residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 10-80 % en hexanos como eluyente dando 150 mg del compuesto del epígrafe como un sólido naranja.

- 45 RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,03 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,33 (m, 5H), 7,06 (m, 2H), 6,27 (d, 1H), 5,27 (s, 2H), 5,13 (m, 1H), 3,99 (m, 2H), 3,75 (m, 1H), 3,63 (m, 2H), 3,24 (m, 2H), 2,03 (m, 2H), 1,25 (d, 3H).

Etapa B: Preparación de 2-[[4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinil]amino]-1-propanol

- 50 Se burbujeó nitrógeno a través de una solución de 2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidro-3-[2-[(2-hidroxi-1-metiletil)amino]-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto de la Etapa A) (107 mg, 0,21 mmol) en metanol (5 ml) durante 5 minutos. A la mezcla de reacción se añadió paladio al 10 % sobre carbón activado (227 mg), y la mezcla resultante se agitó bajo hidrógeno (100 kPa) durante 2 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se filtró a través de una almohadilla de auxiliar de filtrado de tierra de diatomeas Celite®, y el catalizador de paladio se aclaró con metanol y se filtró. Los filtrados reunidos se concentraron y el residuo bruto se

purificó por cromatografía líquida de media presión usando isopropanol al 10-50 % en diclorometano como eluyente dando 47 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,01 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,28 (d, 1H), 5,27 (s, 1H), 5,08 (m, 1H), 4,10 (m, 1H), 3,75 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 3,49 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 2,00 (m, 2H), 1,26 (m, 3H).

5 Ejemplo 6

Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazina (Compuesto 145) y *N*-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-7-metilpirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinamina (Compuesto 135)

Etapas A: Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazina

- 10 Se burbujeó nitrógeno gas a través de una solución de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-5,6-dihidropirazolo[[1,5-*b*]piridazin-7(4*H*)-carboxilato de fenilmetilo (es decir, el producto del Ejemplo 4, Etapa C) (1,0 g, 2,16 mmol) en metanol (10 ml) durante 5 minutos. A la mezcla de reacción se añadió paladio al 10 % sobre carbón activado (229 mg, 23 % en peso), y la mezcla resultante se agitó bajo hidrógeno (100 kPa) a temperatura ambiente durante 1 h. La mezcla de reacción se filtró a través de una almohadilla de auxiliar de filtrado de tierra de diatomeas Celite[®], y el catalizador de paladio se aclaró con metanol y se filtró. Los filtrados reunidos se concentraron y el residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 20 a 100% en hexanos como eluyente dando 180 mg del compuesto del epígrafe como un sólido.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,26 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 7,10 (m, 2H), 6,85 (d, 1H), 5,30 (s, 1H), 3,51 (m, 2H), 3,31 (m, 2H), 2,03 (m, 2H).

- 20 Etapas B: Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-7-metilpirazolo[1,5-*b*]piridazina

- Se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas una mezcla de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-*b*]piridazina (es decir, el producto de la Etapa A) (50,0 mg, 0,15 mmol), yodometano (0,019 ml, 0,31 mmol) y carbonato potásico (63 mg, 0,46 mmol) en *N,N* dimetilformamida (3 ml), seguido por agitación a 50°C durante 1 h y luego a 100°C durante 2 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (3 x 10 ml). La fase orgánica reunida se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida. El residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 20 a 80% en hexanos como eluyente dando 37,4 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

- RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,25 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 7,10 (m, 2H), 6,83 (d, 1H), 3,39 (m, 2H), 3,26 (m, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,05 (m, 2H).

Etapas C: Preparación de *N*-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-7-metilpirazolo[1,5-*b*]piridazin-3-il]-2-pirimidinamina

- Se calentó bajo irradiación de microondas a 150°C durante 30 minutos una solución de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-7-metilpirazolo[1,5-*b*]piridazina (es decir, el producto de la Etapa B) (30,0 mg, 0,087 mmol) y ciclopropilamina (0,31 ml, 4,36 mmol) en 1-metil-2-pirrolidinona (2 ml). La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (3 x 10 ml). Las fases orgánicas reunidas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron a presión reducida. El residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 20 a 80% en hexanos como eluyente dando 27 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

- RMN de ^1H (CDCl_3) δ 8,07 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,28 (d, 1H), 5,23 (s, 1H), 3,38 (m, 2H), 3,23 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,77 (m, 1H), 2,01 (m, 2H), 0,80 (m, 2H), 0,56 (m, 2H).

Ejemplo 7

- Preparación de 2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metilsulfonyl)-4-pirimidinil]-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazina (Compuesto 178) y 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-7*H* pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 112)

Etapas A: Preparación de ácido tetrahidro-2*H*-1,3-oxazin-4-carboxílico

- Se disolvió hidrobromuro de homoserina lactona (5,92 g, 32,5 mmol) en una mezcla de formaldehído (37 % en agua, 16 ml), ácido clorhídrico 1 N (3 ml) y agua (75 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 4 días. El disolvente se evaporó entonces a presión reducida proporcionando un sólido blanco que se suspendió en etanol (100 ml). Después de 15 minutos, los sólidos no disueltos se separaron por filtración y el filtrado se concentró dando aproximadamente 25 ml de residuo bruto. Después de la adición de 25 ml de acetato de etilo, la mezcla bruta se almacenó en un congelador a -10°C durante la noche. El sólido se recogió entonces por filtración dando 4,1 g del compuesto del epígrafe como un sólido blanco.

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ 4,93 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 4,31 (m, 1H), 4,04 (m, 1H), 3,76 (m, 1H), 2,09 (m, 1H), 1,90 (m, 1H).

Etapla B: Preparación de ácido tetrahidro-3-nitroso-2*H*-1,3-oxazin-4-carboxílico

5 Se disolvió ácido tetrahidro-2*H*-1,3-oxazin-4-carboxílico (es decir, el producto de la Etapa A) (2,00 g, 15,3 mmol) en ácido clorhídrico 1 N (12,4 ml), y la solución se enfrió hasta 0°C. Se añadió entonces, en varias porciones nitrito sódico (1,42 g, 20,6 mmol), y la mezcla de reacción se agitó durante 1 h. La mezcla de reacción se extrajo entonces con diclorometano y una vez con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron a presión reducida dando 1,29 g del compuesto del epígrafe como un sólido. Este compuesto tenía pureza suficiente para usarse en posteriores reacciones.

10 RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ 13,51 (s ancho, 1H), 6,01 (d, 1H), 5,52 (d, 1H), 5,27 (d, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,70 (m, 1H), 2,07 (m, 1H), 1,95 (m, 1H).

Etapla C: Preparación de sal interna de 3-hidroxi-7*H*-[1,2,3]oxadiazolo[3,4-*c*][1,3]oxazin-8-io

15 Se disolvió ácido tetrahidro-3-nitroso-2*H*-1,3-oxazin-4-carboxílico (es decir, el producto de la Etapa B) (1,29 g, 8,0 mmol) en éter dietílico (10 ml) y se enfrió hasta 0°C. Se añadió entonces anhídrido trifluoracético (2,0 g, 9,6 mmol) en tres porciones durante 5 minutos. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 1 h y luego se colocó en un congelador a -10°C durante la noche. El sólido formado se aisló por filtración dando 0,99 g del compuesto del epígrafe como un sólido blanco. Este compuesto tenía pureza suficiente para usarse en posteriores reacciones.

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ 5,86 (s, 2H), 4,14 (m, 2H), 2,69 (m, 2H).

Etapla D: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metiltio)-4-pirimidinil]-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazina

20 Se calentó a 160°C durante 24 h una mezcla de 4-[2-(4-fluorofenil)etnil]-2-(metiltio)pirimidina (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa A) (1,26 g, 5,16 mmol) y sal interna de 3-hidroxi-7*H*-[1,2,3]oxadiazolo[3,4-*c*][1,3]oxazin-8-io (es decir, el producto de la Etapa C) (0,99 g, 6,96 mmol) en mesitileno (20 ml). La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, y el aceite residual se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo a 0-100 % en hexanos como eluyente dando 290 mg del compuesto del epígrafe como un sólido blanco.

25 RMN de ^1H (CDCl₃) δ 8,24 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,62 (d, 1H), 5,60 (s, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,34 (m, 2H), 2,51 (s, 3H).

Etapla E: Preparación de 2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazina

30 Se añadió ácido 3-cloroperbenzoico (70 %, 0,290 g, 1,87 mmol) a una solución de 2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metiltio)-4-pirimidinil]-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazina (es decir, el producto de la Etapa D) (0,29 g, 0,85 mmol) en cloroformo (20 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 24 h y seguidamente se lavó tres veces con solución acuosa saturada de Na₂CO₃. La fase orgánica se secó y se concentró dando 0,30 g del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido. Este compuesto tenía pureza suficiente para usarse en posteriores reacciones.

35 RMN de ^1H (CDCl₃) δ 8,53 (d, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,15 (m, 2H), 7,10 (d, 1H), 5,62 (s, 2H), 4,18 (m, 2H), 3,47 (m, 2H), 3,33 (s, 3H).

Etapla F: Preparación de 4-[2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina

40 Se calentó durante 1 hora a 120°C una solución de 2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]-7*H*-pirazolo[1,5-*c*][1,3]oxazina (es decir, el producto de la Etapa E) (0,15 g, 0,4 mmol) e isopropilamina (0,95 g, 16 mmol) en 2,5 ml de cloroformo en un tubo herméticamente cerrado en un reactor de microondas. La mezcla de reacción se concentró entonces a presión reducida y se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 0-100 % en hexanos como eluyente dando 100 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

45 RMN de ^1H (CDCl₃) δ 8,04 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,07 (m, 2H), 6,22 (d, 1H), 5,60 (s, 2H), 4,92 (d, 1H), 4,14 (m, 3H), 3,32 (m, 2H), 1,24 (d, 6H).

Ejemplo 8

Preparación de 4-[2-(2,4-difluorofenil)-4*H*,6*H*-pirazolo[1,5-*c*]tiazol-3-il]-*N*-(2-metoxi-1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 83)

Etapla A: Preparación de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(2,4-difluorofenil)-4*H*,6*H*-pirazolo[1,5-*c*]tiazol

Se calentó a 155-160°C bajo nitrógeno durante 48 horas una solución de 3-hidroxi-4*H*,6*H*-tiazolo[3,4-*c*][1,2,3]oxadiazol-7-*io*, sal interna (0,63 g, 4,3 mmol) (preparado a partir de ácido tiazolidin-4-carboxílico por nitrosación y tratamiento con anhídrido trifluoracético como se describe en Sutcliffe et al. Tetrahedron 2000, 24, 10011-10021) y 4-[2-(2,4-difluorofenil)etilil]-2-cloropirimidina (1,0 g, 4,0 mmol) en mesitileno (15 ml). La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. El residuo bruto se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 0 a 50% en hexanos como eluyente dando 0,09 g del compuesto del epígrafe como un sólido blanco.

RMN de ¹H (CDCl₃) δ 8,33 (d, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,00 (m, 2H), 6,77 (m, 1H), 5,30 (t, 2H), 4,56 (t, 2H).

Etapas B: Preparación de 4-[2-(2,4-difluorofenil)-4*H*,6*H*-pirazolo[1,5-*c*]tiazol-3-il]-*N*-(2-metoxi-1-metiletil)-2-pirimidinamina

Se calentó una mezcla de 3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(2,4-difluorofenil)-4*H*,6*H*-pirazolo[1,5-*c*]tiazol (es decir, el producto de la Etapa A) (0,090 g, 0,27 mmol) e isopropilamina (1,00 ml, 11,8 mmol) en cloroformo (2 ml) en un tubo herméticamente cerrado en un reactor de microondas a 150°C durante 1 h. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice usando acetato de etilo de 10 a 100% en hexanos como eluyente dando 50 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un aceite amarillo pálido.

RMN de ¹H (CDCl₃) δ 8,03 (d, 1H), 7,47 (m, 1H), 6,99 (m, 1H), 6,91 (m, 1H), 6,12 (dd, 1H), 5,28 (t, 2H), 4,84 (s, 1H), 4,50 (t, 2H), 4,05 (m, 1H), 1,23 (d, 6H).

Ejemplo 9

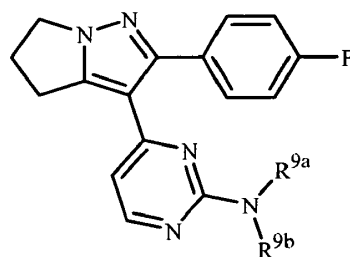
Preparación de 4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-5,5-dioxido-4*H*-pirazolo[5,1-*c*][1,4]tiazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (Compuesto 114)

Se añadió ácido 3-cloroperbenzoico (70 %, 0,10 g, 0,68 mmol) a una solución de 4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4*H*-pirazolo[5,1-*c*][1,4]tiazin-3-il]-*N*-(1-metiletil)-2-pirimidinamina (preparada usando un procedimiento análogo al Ejemplo 8) en cloroformo (10 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 24 h y seguidamente se lavó tres veces con solución acuosa saturada de Na₂CO₃. La fase orgánica se secó, se concentró y se purificó por cromatografía líquida de media presión usando acetato de etilo de 0-100 % en hexanos como eluyente dando 14 mg del producto del epígrafe, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco.

RMN de ¹H (CDCl₃) δ 8,04 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 7,10 (m, 2H), 6,16 (d, 1H), 5,02 (d, 1H), 4,89 (s, 2H), 4,86 (m, 2H), 4,11 (m, 1H), 3,59 (m, 2H), 1,28 (d, 6H).

Mediante los procedimientos descritos en este documento, junto con métodos conocidos en la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1A a 6. En las Tablas se usan las siguientes abreviaturas que se muestran a continuación: *t* significa terciario, *s* significa secundario, *n* significa normal, *i* significa iso, *c* significa ciclo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, *i*-Pr significa isopropilo, Bu significa butilo, Hex significa hexilo, OMe significa metoxi, SMe significa metiltio, -CN significa ciano, Ph significa fenilo, -NO₂ significa nitro, SO₂ significa S(O)₂, S(O)Me significa metilsulfinilo y S(O)₂Me significa metilsulfonilo. Los sustituyentes R^{9a} y R^{9b} se numeran comenzando por la posición en la que estos están unidos al resto de la Fórmula 1.

TABLA 1A



R^{9b} es H.

R ^{9a}	R ^{9a}	R ^{9a}	R ^{9a}
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph

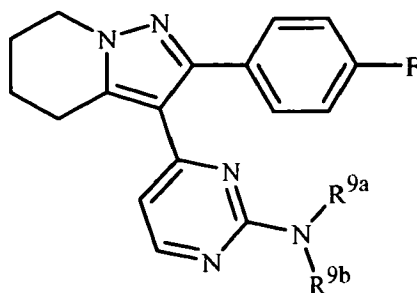
(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
R ^{9b} es H.			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
R ^{9b} es CH ₃ .			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et

(continuación)

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$
c-Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)-n-Bu$
c-pentilo	$CH_2CH_2CH_2F$	CH_2CO_2-i-Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	$CH_2CF_2CF_3$	$CH(Me)CO_2Me$	$CH_2CH_2CH(Me)_2$
2-ciclohexenilo	$CH_2CH_2CF_3$	$CH_2C(O)Me$	
3-ciclohexenilo	$CH_2CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2C(O)Me$	
CH_2-c-Pr	$(S)-CH_2)CH(Me)CF_3$	CH_2SiMe_3	
$CH_2-c-Hex$	$CH_2CH_2CH_2CH_2F$	$CH_2CH_2SiMe_3$	

TABLA 1B

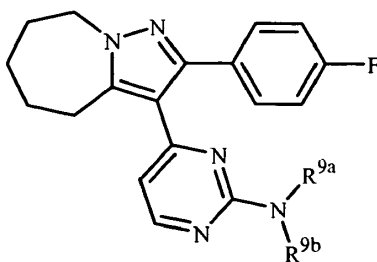


R^{9b} es H.			
R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
Me	$CH_2-2-ciclohexenilo$	2-cloro-2-propenilo	CH_2OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	$CH_2-2-tetrahidrofuranilo$	CH_2CH_2Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	$CH_2-2-tetrahidropiranilo$	$CH(Me)Ph$
<i>i</i> -Bu	Ph	CH_2CN	$CH_2-2-Cl-Ph$
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	$CH_2-3-Cl-Ph$
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH_2CH_2OH	$CH_2-4-Cl-Ph$
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH_2CH_2OMe	$CH_2-2-tienilo$
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	$CH_2CH(Me)OMe$	$CH_2-2-piridinilo$
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	$CH(Me)CH_2OMe$	$CH_2-3-piridinilo$
2-propenilo	2-pirazinilo	$CH(Me)CH(OMe)_2$	$CH(Et)_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	$CH_2-2-dioxolanilo$	$CH_2CH(Et)_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$
c-Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)-n-Bu$
c-pentilo	$CH_2CH_2CH_2F$	CH_2CO_2-i-Pr	2,2-dimetilpropilo

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
c-Hex	$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}(\text{Me})\text{CO}_2\text{Me}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})_2$
2-ciclohexenilo	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$	
3-ciclohexenilo	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$	
$\text{CH}_2\text{-c-Pr}$	$(\text{S})\text{-CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$	CH_2SiMe_3	
$\text{CH}_2\text{-c-Hex}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SiMe}_3$	
R^{9b} es CH_3 .			
$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	$\text{CH}_2\text{-2-ciclohexenilo}$	2-cloro-2-propenilo	CH_2OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	$\text{CH}_2\text{-2-tetrahidrofuranilo}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	$\text{CH}_2\text{-2-tetrahidropiranilo}$	$\text{CH}(\text{Me})\text{Ph}$
<i>i</i> -Bu	Ph	CH_2CN	$\text{CH}_2\text{-2-Cl-Ph}$
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	$\text{CH}_2\text{-3-Cl-Ph}$
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	$\text{CH}_2\text{-4-Cl-Ph}$
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CHCH_2OMe	$\text{CH}_2\text{-2-tienilo}$
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{OMe}$	$\text{CH}_2\text{-2-piridinilo}$
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	$\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{OMe}$	$\text{CH}_2\text{-3-piridinilo}$
2-propenilo	2-pirazinilo	$\text{CH}(\text{Me})\text{CH}(\text{OMe})_2$	$\text{CH}(\text{Et})_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	$\text{CH}_2\text{-2-dioxolanilo}$	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCF}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{n-Pr})\text{Me}$
3-pentenilo	CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	$\text{CH}(\text{Me})\text{Et}$
2-propinilo	CF_2CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{SMe}$	$\text{CH}(\text{Me})\text{-n-Pr}$
3-butinilo	CH_2CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$	$\text{CH}(\text{CF}_3)\text{Et}$
2-butinilo	$\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$	$\text{CH}(\text{Et})\text{-n-Pr}$
<i>c</i> -Pr	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	$\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$	$\text{CH}(\text{Me})\text{-n-Bu}$
<i>c</i> -pentilo	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	$\text{CH}_2\text{CO}_2\text{-i-Pr}$	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}(\text{Me})\text{CO}_2\text{Me}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})_2$
2-ciclohexenilo	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$	
3-ciclohexenilo	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$	
$\text{CH}_2\text{-c-Pr}$	$(\text{S})\text{-CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$	CH_2SiMe_3	
$\text{CH}_2\text{-c-Hex}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SiMe}_3$	

TABLA 1C



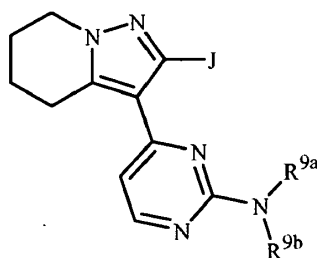
(continuación)

R^{9b} es H. $\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
R^{9b} es CH ₃ . $\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ P
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et

(continuación)

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$
c-Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)-n-Bu$
c-pentilo	$CH_2CH_2CH_2F$	CH_2CO_2-i-Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	$CH_2CF_2CF_3$	$CH(Me)CO_2Me$	$CH_2CH_2CH(Me)_2$
2-ciclohexenilo	$CH_2CH_2CF_3$	$CH_2C(O)Me$	
3-ciclohexenilo	$CH_2CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2C(O)Me$	
CH_2-c-Pr	$(S)-CH_2CH(Me)CF_3$	CH_2SiMe_3	
$CH_2-c-Hex$	$CH_2CH_2CH_2CH_2F$	$CH_2CH_2SiMe_3$	

Tabla 2

J es Ph y R^{9b} es H.

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
Me	$CH_2-2-ciclohexenilo$	2-cloro-2-propenilo	CH_2OPh
Et	4-tetrahidropiraniilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
i-Pr	3-tetrahidropiraniilo	$CH_2-2-tetrahidrofuranilo$	CH_2CH_2Ph
n-Pr	3-tetrahidrofuranilo	$CH_2-2-tetrahidropiraniilo$	$CH(Me)Ph$
i-Bu	Ph	CH_2CN	$CH_2-2-Cl-Ph$
n-Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	$CH_2-3-Cl-Ph$
s-Bu	3-Cl-fenilo	CH_2CH_2OH	$CH_2-4-Cl-Ph$
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH_2CH_2OMe	$CH_2-2-tienilo$
n-pentilo	2-piridinilo	$CH_2CH(Me)OMe$	$CH_2-2-piridinilo$
n-Hex	2-pirimidinilo	$CH(Me)CH_2OMe$	$CH_2-3-piridinilo$

J es Ph y R^{9b} es H.

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
2-propenilo	2-pirazinilo	$CH(Me)CH(OMe)_2$	$CH(Et)_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	$CH_2-2-dioxolanilo$	$CH_2CH(Et)_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$
c-Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)-n-Bu$

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
c-pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 2-F-Ph y R ^{9b} es H.			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiraniolo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiraniolo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiraniolo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
c-pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 2-Cl-Ph y R ^{9b} es H.			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiraniolo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiraniolo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiraniolo	CH(Me)Ph

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 4-Cl-Ph y R ^{9b} es H.			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 3-Me-Ph y R ^{9b} es H.			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es Ph y R ^{9b} es CH ₃ .			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiraniolo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiraniolo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 2-F-Ph y R ^{9b} es CH ₃ .			
$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiraniolo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiraniolo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiraniolo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Mc	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 2-Cl-Ph y R ^{9b} es CH ₃ .			
$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
J es 4-Cl-Ph y R ^{9b} es CH ₃ .			
$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butenilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butenilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

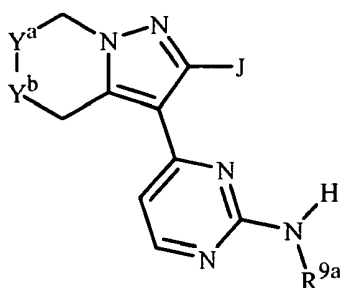
J es 3-Me-Ph y R^{9b} es CH₃.

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂

(continuación)

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$
c-Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)-n-Bu$
c-pentilo	$CH_2CH_2CH_2F$	CH_2CO_2-i-Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	$CH_2CF_2CF_3$	$CH(Me)CO_2Me$	$CH_2CH_2CH(Me)_2$
2-ciclohexenilo	$CH_2CH_2CF_3$	$CH_2C(O)Me$	
3-ciclohexenilo	$CH_2CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2C(O)Me$	
CH_2-c-Pr	$(S)-CH_2CH(Me)CF_3$	CH_2SiMe_3	
$CH_2-c-Hex$	$CH_2CH_2CH_2CH_2F$	$CH_2CH_2SiMe_3$	

Tabla 3

Y^a es CH₂, Y^b es O y J es Ph.

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
Me	CH_2 -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH_2OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH_2 -2-tetrahidrofuranilo	CH_2CH_2Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH_2 -2-tetrahidropiranilo	$CH(Me)Ph$
<i>i</i> -Bu	Ph	CH_2CN	CH_2 -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	CH_2 -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH_2CH_2OH	CH_2 -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH_2CH_2OMe	CH_2 -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	$CH_2CH(Me)OMe$	CH_2 -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	$CH(Me)CH_2OMe$	CH_2 -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	$CH(Me)CH(OMe)_2$	$CH(Et)_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH_2 -2-dioxolanilo	$CH_2CH(Et)_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
c-Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
c-pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es O y J es 4-F-Ph.

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es O y J es 2-F-Ph.

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es O y J es 2-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
c-Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ -c-Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ -c-Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es O y J es 4-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
s-Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
c-Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
c-pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ -c-Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ -c-Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es O y J es 3-Me-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
s-Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es SO₂ y J es Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es SO₂ y J es 4-F-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es SO₂ y J es 2-F-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es SO₂ y J es 2-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
CH ₂ -c-Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
Y ^a es CH ₂ , Y ^b es SO ₂ y J es 4-Cl-Ph.			
$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ -c-Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ -c-Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es SO₂ y J es 3-Me-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
Y ^a es O, Y ^b es CH ₂ y J es Ph.			
<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	
Y ^a es O, Y ^b es CH ₂ y J es 4-F-Ph.			

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es O, Y^b es CH₂ y J es 2-F-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es O, Y^b es CH₂ y J es 2-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es O, Y^b es CH₂ y J es 4-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh

(continuación)

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH_2 -2-tetrahidrofuranilo	CH_2CH_2Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH_2 -2-tetrahidropiranilo	$CH(Me)Ph$
<i>i</i> -Bu	Ph	CH_2CN	CH_2 -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	CH_2 -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH_2CH_2OH	CH_2 -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH_2CH_2OMe	CH_2 -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	$CH_2CH(Me)OMe$	CH_2 -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	$CH(Me)CH_2OMe$	CH_2 -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	$CH(Me)CH(OMe)_2$	$CH(Et)_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH_2 -2-dioxolanilo	$CH_2CH(Et)_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)-n-Pr$
<i>c</i> -Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)-n-Bu$
<i>c</i> -pentilo	$CH_2CH_2CH_2F$	CH_2CO_2-i-Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	$CH_2CF_2CF_3$	$CH(Me)CO_2Me$	$CH_2CH_2CH(Me)_2$
2-ciclohexenilo	$CH_2CH_2CF_3$	$CH_2C(O)Me$	
3-ciclohexenilo	$CH_2CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2C(O)Me$	
CH_2-c-Pr	(<i>S</i>)- $CH_2CH(Me)CF_3$	CH_2SiMe_3	
$CH_2-c-Hex$	$CH_2CH_2CH_2CH_2F$	$CH_2CH_2SiMe_3$	

Y^a es O, Y^b es CH_2 y J es 3-Me-Ph.

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
Me	CH_2 -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH_2OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH_2 -2-tetrahidrofuranilo	CH_2CH_2Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH_2 -2-tetrahidropiranilo	$CH(Me)Ph$
<i>i</i> -Bu	Ph	CH_2CN	CH_2 -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	CH_2 -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH_2CH_2OH	CH_2 -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH_2CH_2OMe	CH_2 -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	$CH_2CH(Me)OMe$	CH_2 -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	$CH(Me)CH_2OMe$	CH_2 -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	$CH(Me)CH(OMe)_2$	$CH(Et)_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH_2 -2-dioxolanilo	$CH_2CH(Et)_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)-n-Pr$

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es S y J es Ph.

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es S y J es 4-F-Ph.

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph

(continuación)

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es S y J es 2-F-Ph.

<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>	<u>R^{9a}</u>
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
c-Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
c-pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es S y J es 2-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Y^a es CH₂, Y^b es S y J es 4-Cl-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph

(continuación)

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(S)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

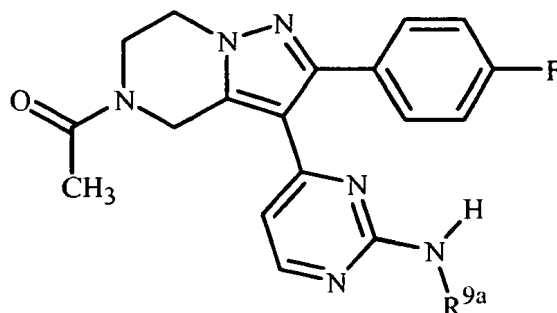
Y^a es CH₂, Y^b es S y J es 3-Me-Ph.

$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo

(continuación)

R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
c-Hex	$CH_2CF_2CF_3$	$CH(Me)CO_2Me$	$CH_2CH_2CH(Me)_2$
2-ciclohexenilo	$CH_2CH_2CF_3$	$CH_2C(O)Me$	
3-ciclohexenilo	$CH_2CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2C(O)Me$	
CH_2 -c-Pr	(S)- $CH_2CH(Me)CF_3$	CH_2SiMe_3	
CH_2 -c-Hex	$CH_2CH_2CH_2CH_2F$	$CH_2CH_2SiMe_3$	

Tabla 4A



R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}	R^{9a}
Me	CH_2 -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH_2OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH_2Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH_2 -2-tetrahidrofuranilo	CH_2CH_2Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH_2 -2-tetrahidropiranilo	$CH(Me)Ph$
<i>i</i> -Bu	Ph	CH_2CN	CH_2 -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH_2NO_2	CH_2 -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH_2CH_2OH	CH_2 -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH_2CH_2OMe	CH_2 -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	$CH_2CH(Me)OMe$	CH_2 -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	$CH(Me)CH_2OMe$	CH_2 -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	$CH(Me)CH(OMe)_2$	$CH(Et)_2$
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH_2 -2-dioxolanilo	$CH_2CH(Et)_2$
3-butenilo	2-oxazolilo	$CH_2CH_2OCF_3$	$CH_2CH(n-Pr)Me$
3-pentenilo	CF_3	CH_2CH_2SMe	$CH(Me)Et$
2-propinilo	CF_2CF_3	$CH_2CH(Me)SMe$	$CH(Me)$ - <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH_2CF_3	$CH_2CH_2S(O)Me$	$CH(CF_3)Et$
2-butinilo	$CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)$ - <i>n</i> -Pr
c-Pr	CH_2CH_2F	CH_2CO_2Me	$CH(Me)$ - <i>n</i> -Bu
c-pentilo	$CH_2CH_2CH_2F$	CH_2CO_2 - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
c-Hex	$CH_2CF_2CF_3$	$CH(Me)CO_2Me$	$CH_2CH_2CH(Me)_2$
2-ciclohexenilo	$CH_2CH_2CF_3$	$CH_2C(O)Me$	
3-ciclohexenilo	$CH_2CH(Me)CF_3$	$CH_2CH_2C(O)Me$	
CH_2 -c-Pr	(S)- $CH_2CH(Me)CF_3$	CH_2SiMe_3	

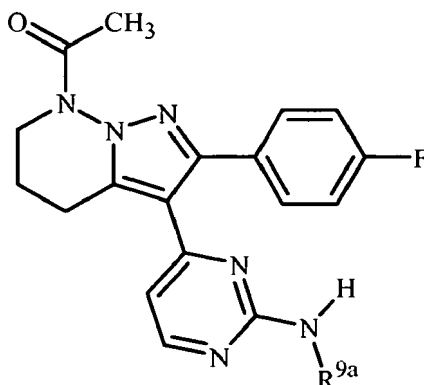
(continuación)

 $\underline{R^{9a}}$
 CH₂-c-Hex

 $\underline{R^{9a}}$
 CH₂CH₂CH₂CH₂F

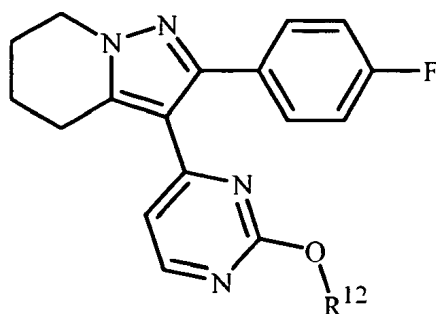
 $\underline{R^{9a}}$
 CH₂CH₂SiMe₃
 $\underline{R^{9a}}$

TABLA 4B



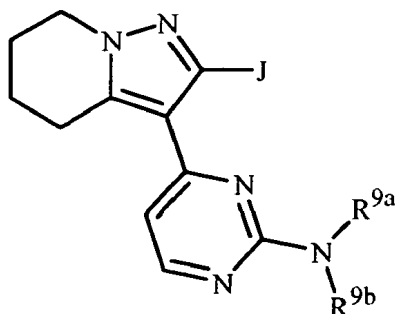
$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$	$\underline{R^{9a}}$
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ -c-Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ -c-Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Tabla 5



R^{12}	R^{12}	R^{12}	R^{12}
Me	CH ₂ -2-ciclohexenilo	2-cloro-2-propenilo	CH ₂ OPh
Et	4-tetrahidropiranilo	3,3-dicloro-2-propenilo	CH ₂ Ph
<i>i</i> -Pr	3-tetrahidropiranilo	CH ₂ -2-tetrahidrofuranilo	CH ₂ CH ₂ Ph
<i>n</i> -Pr	3-tetrahidrofuranilo	CH ₂ -2-tetrahidropiranilo	CH(Me)Ph
<i>i</i> -Bu	Ph	CH ₂ CN	CH ₂ -2-Cl-Ph
<i>n</i> -Bu	2-Cl-fenilo	CH ₂ NO ₂	CH ₂ -3-Cl-Ph
<i>s</i> -Bu	3-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ -4-Cl-Ph
3-Me-Bu	4-Cl-fenilo	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ -2-tienilo
<i>n</i> -pentilo	2-piridinilo	CH ₂ CH(Me)OMe	CH ₂ -2-piridinilo
<i>n</i> -Hex	2-pirimidinilo	CH(Me)CH ₂ OMe	CH ₂ -3-piridinilo
2-propenilo	2-pirazinilo	CH(Me)CH(OMe) ₂	CH(Et) ₂
2-Me-2-propenilo	2-tiazolilo	CH ₂ -2-dioxolanilo	CH ₂ CH(Et) ₂
3-butenilo	2-oxazolilo	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	CH ₂ CH(<i>n</i> -Pr)Me
3-pentenilo	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)Et
2-propinilo	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)- <i>n</i> -Pr
3-butinilo	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(CF ₃)Et
2-butinilo	CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)- <i>n</i> -Pr
<i>c</i> -Pr	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ Me	CH(Me)- <i>n</i> -Bu
<i>c</i> -pentilo	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CO ₂ - <i>i</i> -Pr	2,2-dimetilpropilo
<i>c</i> -Hex	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)CO ₂ Me	CH ₂ CH ₂ CH(Me) ₂
2-ciclohexenilo	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)Me	
3-ciclohexenilo	CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)Me	
CH ₂ - <i>c</i> -Pr	(<i>S</i>)-CH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ SiMe ₃	
CH ₂ - <i>c</i> -Hex	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	

Tabla 6



R^{9a} es *i*-Pr y R^{9b} es H.

<u>J</u>	<u>J</u>	<u>J</u>
1-naftalenilo	2-piridinilo	2-tiazolilo
2-naftalenilo	3-piridinilo	4-tiazolilo
2-tienilo	4-piridinilo	3-isoxazolinilo
3-tienilo	2-pirimidinilo	1-Me-imidazol-2-ilo
2-oxazolilo	4-pirimidinilo	1-Me-imidazol-5-ilo
4-oxazolilo	2-pirazinilo	ciclohexilo

R^{9a} es ciclopropilo y R^{9b} es H.

<u>J</u>	<u>J</u>	<u>J</u>
1-naftalenilo	2-piridinilo	2-tiazolilo
2-naftalenilo	3-piridinilo	4-tiazolilo
2-tienilo	4-piridinilo	3-isoxazolinilo
3-tienilo	2-pirimidinilo	1-Me-imidazol-2-ilo
2-oxazolilo	4-pirimidinilo	1-Me-imidazol-5-ilo
4-oxazolilo	2-pirazinilo	ciclohexilo

R^{9a} es CH(Me)CH₂OMe y R^{9b} es H.

<u>J</u>	<u>J</u>	<u>J</u>
1-naftalenilo	2-piridinilo	2-tiazolilo
2-naftalenilo	3-piridinilo	4-tiazolilo
2-tienilo	4-piridinilo	3-isoxazolinilo
3-tienilo	2-pirimidinilo	1-Me-imidazol-2-ilo
2-oxazolilo	4-pirimidinilo	1-Me-imidazol-5-ilo
4-oxazolilo	2-pirazinilo	ciclohexilo

R^{9a} es CH(Me)CH₂OH y R^{9b} es H.

<u>J</u>	<u>J</u>	<u>J</u>
1-naftalenilo	2-piridinilo	2-tiazolilo
2-naftalenilo	3-piridinilo	4-tiazolilo
2-tienilo	4-piridinilo	3-isoxazolinilo
3-tienilo	2-pirimidinilo	1-Me-imidazol-2-ilo
2-oxazolilo	4-pirimidinilo	1-Me-imidazol-5-ilo
4-oxazolilo	2-pirazinilo	ciclohexilo

Formulación/Utilidad

Un compuesto de la presente invención se usará por lo general como ingrediente activo fungicida en una composición, es decir, formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirven como vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para que sean coherentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores medioambientales tales como tipo de tierra, humedad y temperatura.

Formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen disoluciones (incluyendo concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse hasta geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado para suspensiones, suspensión para cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión en aceite.

Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos de espolvoreo, polvos, gránulos, aglomerados, globulillos, pastillas, comprimidos, películas cargadas (incluyendo revestimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y los revestimientos formados a partir de disoluciones pelculígenas o suspensiones fluidas son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y formando además en una suspensión o formulación sólida; como alternativa, la formulación entera del ingrediente activo puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Un gránulo emulsionable combina las ventajas tanto de una formulación de concentrado emulsionable como de una formulación granular seca. Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como intermedios para la formulación adicional.

Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes de la pulverización. Tales formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más típicamente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden mezclarse en depósito con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden dosificarse directamente en sistemas de irrigación por goteo o dosificarse en el surco durante el plantado. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse sobre semillas de cultivos y otra vegetación deseable como tratamientos para semillas antes del plantado para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje a través de captación sistémica.

Las formulaciones contendrán típicamente cantidades eficaces de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo, dentro de los siguientes intervalos aproximados que constituyen hasta 100 por cien en peso.

	Porcentaje en Peso		
	<u>Ingrediente Activo</u>	<u>Diluyente</u>	<u>Tensioactivo</u>
Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua y Solubles en Agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones en aceite, Suspensiones, Emulsiones, Disoluciones (incluyendo Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos de Espolvoreo	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Aglomerados	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones de Alta Potencia	90-99	0-10	0-2

Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra de diatomeas, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato sódico y sulfato sódico. Se describen diluyentes sólidos típicos en Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2ª Ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.

Diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, dimetilsulfóxido, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarburos aromáticos, compuestos alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-

- pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos y γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, diacetona alcohol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres glicéricos de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente C₆-C₂₂), tales como aceites de semillas y frutos de planta (por ejemplo, aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semillas de uva, cártamo, algodón, soja, colza, coco y almendra de palma), grasas de fuentes animales (por ejemplo, sebo de ternero, sebo de cerdo, manteca, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y sus mezclas. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados) en donde los ácidos grasos pueden obtenerse mediante hidrólisis de ésteres de glicerol procedentes de fuentes vegetales y animales, y pueden purificarse mediante destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, Solvents Guide, 2^a Ed., Interscience, Nueva York, 1950.
- Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes surfactantes") generalmente modifican, lo más a menudo reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula tensioactiva, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes antiespumantes.
- Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero no se limitan a: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluyendo los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácido graso, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros al azar, copolímeros de bloques, resinas alquídicas de peg (polietilenglicol), polímeros de injerto o tipo peine y polímeros de estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos basados en silicona; y derivados de azúcar tales como ésteres de sacarosa, alquilpoliglicósidos y alquilpolisacáridos.
- Tensioactivos aniónicos útiles incluyen, aunque no se limitan a: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina tales como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres fosfato tales como ésteres fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos basados en proteínas; derivados de sarcosina; sulfato de estirilfenoléter; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquilauros; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil- y tridecil-bencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de dialquilsulfosuccinato.
- Tensioactivos catiónicos útiles incluyen, aunque no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilentríaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de las aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o sus mezclas); sales de amina tales como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina.
- También son útiles para las presentes composiciones mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas incluyendo McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, Ediciones Americana e Internacional anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Enciclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Séptima Edición, John Wiley and Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de esta invención también pueden contener adyuvantes de formulación y aditivos, conocidos por los expertos en la técnica como auxiliares de formulación (algunos de los cuales puede considerarse que también funcionan como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Tales adyuvantes de formulación y aditivos pueden controlar: el pH (tampones), la espumación durante el procesamiento (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación de los ingredientes activos (agentes de suspensión), la viscosidad (espesantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano dentro del recipiente (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (colorantes/dispersiones de pigmento), la eliminación por lavado (formadores de película o adherentes), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, poli(alcoholes vinílicos), copolímeros de poli(alcohol vinílico) y ceras. Ejemplos de adyuvantes de formulación y aditivos incluyen los enumerados en McCutcheon's Volumen 2: Functional Materials, ediciones Norteamericana e Internacional anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la Publicación PCT WO 03/024222.

El compuesto de Fórmula 1 y cualquier otro ingrediente activo se incorpora típicamente en las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o triturando en un diluyente líquido o seco. Las disoluciones, que incluyen concentrados emulsionables, se pueden preparar por simple mezcla de los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada al uso como un concentrado emulsionable es inmiscible en agua, se añade típicamente un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el agente activo en la dilución con agua. Las suspensiones de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2,000 μm , pueden molerse en húmedo usando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio por debajo de 3 μm . Las suspensiones acuosas puede convertirse en concentrados para suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3,060,084) o procesarse adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas requieren habitualmente procedimientos de molienda en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 μm . Los polvos de espolvoreo y los polvos pueden prepararse mediante mezcla y habitualmente molienda (tal como con un molino de martillos o un molino de energía de fluidos). Los gránulos y aglomerados pueden prepararse por pulverización del material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, páginas 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Los aglomerados pueden prepararse como se describe en el documento U.S. 4,172,714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se muestra en los documentos U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 y DE 3,246,493. Los comprimidos pueden prepararse como se muestra en los documentos U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 y U.S. 5,208,030. Las películas pueden prepararse como se muestra en los documentos GB 2,095,558 y U.S. 3,299,566.

Para información adicional respecto a la técnica de la formulación, véanse T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, páginas 120-133. Véanse también el documento U.S. 3,235,361, de la Col. 6, línea 16 a la Col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; el documento U.S. 3,309,192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; el documento U.S. 2,891,855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan por las rutas convencionales. Los números de compuesto se refieren a compuestos en las Tablas de Índice A-F. Sin elaboración adicional, se cree que el experto en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención hasta su grado más completo. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos pretenden ser únicamente ilustrativos y no limitantes de la descripción de ningún modo. Los porcentajes están en peso excepto cuando se indique otra cosa.

Ejemplo A

Concentrado de Alta Potencia

Compuesto 1	98,5%
aerogel de sílice	0,5%
sílice fino amorfo sintético	1,0%

Ejemplo B

Polvo Humectable

Compuesto 2	65,0%
Dodecilfenol-polietilenglicol-éter	2,0%
Ligninsulfonato de sodio	4,0%
Silicoaluminato de sodio	6,0%
Montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

Compuesto 3	10,0%
Gránulos de atapulgita (bajo contenido en materia volátil, 0,71/0,30 mm; Tamices U.S.S. Nº 25-50)	90,0%

5 Ejemplo D

Aglomerado Extrudido

Compuesto 2	25,0%
Sulfato de sodio anhidro	10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
Alquilnaftalenosulfonato de sodio	1,0%
Bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo E

Concentrado Emulsionable

Compuesto 3	10,0%
hexoleato de polioxietilensorbitol	20,0%
éster metílico de ácidos grasos C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ejemplo F

10 Microemulsión

Compuesto 4	5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
Alquilpoliglicósido	30,0%
Monooleato de glicerilo	15,0%
Agua	20,0%

Ejemplo G

Tratamiento de semilla

Compuesto 1	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
Cera montana	5,00%
Ligninsulfonato de calcio	1,00%
Copolímeros de bloques de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Alcohol estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganosilano	0,20%
Tinte de colorante rojo	0,05%
Agua	65,75%

Los compuestos de esta invención son útiles como agentes para el control de enfermedades en plantas. La presente invención, por tanto, comprende además un procedimiento para controlar enfermedades en plantas causadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o a una porción de la misma que se va a proteger, o a la semilla de la planta que se va a proteger, una cantidad eficaz de un compuesto de la invención o una composición fungicida que contiene dicho compuesto. Los compuestos y/o las composiciones de esta invención proporcionan el control de enfermedades provocadas por un amplio espectro de patógenos fúngicos de planta en las clases de basidiomicetos, ascomicetos, oomicetos y deuteromicetos. Son eficaces para controlar un amplio espectro de enfermedades de plantas, particularmente patógenos foliares de cultivos de plantas ornamentales, césped, hortalizas, de campo, cereales y frutales. Estos patógenos incluyen: oomicetos, incluyendo enfermedades provocadas por *Phytophthora* tales como *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* y *Phytophthora capsici*, enfermedades provocadas por *Pythium* tales como *Pythium aphanidermatum* y enfermedades en la familia *Peronosporaceae* tales como *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (incluyendo *Peronospora tabacina* y *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (incluyendo *Pseudoperonospora cubensis*) y *Bremia lactucae*; ascomicetos, incluyendo enfermedades provocadas por *Alternaria* tales como *Alternaria solani* y *Alternaria brassicae*, enfermedades provocadas por *Guignardia* tales como *Guignardia bidwellii*, enfermedades provocadas por *Venturia* tales como *Venturia inaequalis*, enfermedades provocadas por *Septoria* tales como *Septoria nodorum* y *Septoria tritici*, enfermedades del mildiu pulverulento tales como *Erysiphe* spp. (incluyendo *Erysiphe graminis* y *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Podosphaera leucotricha*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, enfermedades provocadas por *Botrytis* tales como *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, enfermedades provocadas por *Sclerotinia* tales como *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, enfermedades provocadas por *Helminthosporium* tales como *Helminthosporium tritici repens*, *Pyrenophora teres*, enfermedades de antracnosis tales como *Glomerella* o *Colletotrichum* spp. (tales como *Colletotrichum graminicola* y *Colletotrichum orbiculare*), y *Gaeumannomyces graminis*; basidiomicetos, incluyendo enfermedades de roya provocadas por *Puccinia* spp. (tales como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* y *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* y *Phakopsora pachyrhizi*; otros patógenos incluyendo *Rhizoctonia* spp. (tales como *Rhizoctonia solani*); enfermedades provocadas por *Fusarium* tales como *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* y *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rhynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* y *Cercospora beticola*; y otros géneros y especies estrechamente relacionados con estos patógenos. Además de su actividad fungicida, las composiciones o combinaciones también tienen actividad contra bacterias tales como *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae* y otras especies relacionadas.

El control de las enfermedades de plantas se lleva a cabo habitualmente aplicando una cantidad eficaz de un compuesto de esta invención, bien antes o después de la infección, a la porción de la planta a proteger tal como las raíces, tallos, follaje, fruto, semillas, tubérculos o bulbos, o al medio (suelo o arena) en el que las plantas a proteger crecen. Los compuestos también se pueden aplicar a las semillas que se van a proteger y a plántulas que se desarrollen a partir de las semillas. Los compuestos también se pueden aplicar mediante la irrigación del agua para tratar las plantas.

Las dosis de aplicación para estos compuestos pueden estar influenciadas por muchos factores del entorno y se determinarán a tenor de las condiciones reales de uso. Normalmente, el follaje se protege cuando se trata a una dosis de menos de aproximadamente 1 g/a a aproximadamente 5.000 g/ha de ingrediente activo. Las semillas y las plántulas pueden protegerse normalmente cuando las semillas se tratan a una dosis de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semillas.

Los compuestos de esta invención también se pueden mezclar con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos distintos incluyendo fungicidas, insecticidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas,

herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento tales como inhibidores de la muda de insectos y estimulantes de las raíces, esterilizantes químicos, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, nutrientes de las plantas, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenas, virus u hongos para formar un pesticida multicomponente que aporte un espectro de protección agrícola incluso más amplio. Así, la presente invención también se refiere a una composición que comprende una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de Fórmula 1 y una cantidad biológicamente eficaz de al menos otro compuesto o agente biológicamente activo y puede comprender además al menos un tensioactivo, un diluyente sólido o un diluyente líquido. Los otros compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse en composiciones que comprenden al menos uno de un tensioactivo y un diluyente sólido o líquido. Para mezclas de la presente invención, se pueden formular uno o más compuestos o agentes biológicamente activos distintos junto con un compuesto de Fórmula 1, para formar una premezcla, se pueden formular por separado uno o más compuestos o agentes biológicamente activos distintos del compuesto de Fórmula 1, y combinarse las formulaciones entre sí antes de la aplicación (por ejemplo, en un depósito para pulverización) o, como alternativa, aplicarse de forma sucesiva.

Ejemplos de dichos compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular los compuestos de esta invención son: insecticidas tales como abamectina, acefato, acetamiprida, amidoflomet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, buprofezina, carbofurano, cartap, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clotianidina, ciflufmetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenthiuron, diazinona, dieldrina, diflubenfuron, dimetiltrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenimer (UR-50701), flufenoxuron, fonofos, halofenozida, hexaflumuron, hidrametilnona, imidacloprida, indoxacarb, isofenfos, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidation, metomil, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofos, metoxifenozida, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamil, paration, paration-metilo, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridilil, pirifluquinazona, piriprol, priproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramat, sulprofos, tebufenozida, teflubenzuron, teflutrina, terbufos, tetracloprifos, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triclorfona y triflumuron; fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, aldimorf, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina benalaxil, benalaxil-M, benodanil, benomil, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, betoxazin, binapacril, bifenilo, bitertanol, bixafeno, blasticidina-S, mezcla Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalid, bromuconazol, bupirimate, captafol, captano, carbendazim, carboxina, carpropamid, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, clotrimazol, oxiclورو de cobre, sales de cobre como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, diclofluanid, diclocimet, diclomizina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumentorim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina diniconazol, diniconazol-M, dinocap, ditianon, dodemorf, dodina, edifenfos, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil, fencpiclonil, fenpropidin, fenpropimorf, acetato de fentin, cloruro de fentin, hidróxido de fentin, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxil, furametpir, guazatina, hexaconazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, albisilato de iminotadina, triacetato de iminotadina, yodocarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, isotianil, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepanipirim, mepronil, meptildinocap, metalaxil, metalaxil-M, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin metrafenona, miclobutanil, naftifina, neo-asozin (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilina, ofurace, orisastrobina oxadixilo, ácido oxolinico, oxpoconazol, oxicarboxin, oxitetraciclina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, pentiopirad, ácido fosfórico y sus sales, ftalida, picoxistrobina piperalin, polioxin, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb-hidrocloruro, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, protioconazol, pirazofos, piraclostrobina piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, pirrolnitrin, poroquilon, quinometionato, quinoxifeno, quitozeno, siltiofamid, simeconazol, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tefluzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, tolclofos-metilo, tolfenurid, triadimefon, triadimenol, triazoxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenal, vinclozolin, zineb, ziram, zoxamida, *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida, *N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-bicyclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida, α -[metoxiimino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etoxi]imino]metil]bencenoacetamida, 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-iliden]amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)-*N*-metilbencenoacetamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidiniliden]acetonitrilo, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]-metil]propil]carbamato de 4-fluorofenilo, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, *N*-[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-bencenoacetamida, *N*'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida y 1-[(2-propenil)tiocarbonil]-2-(1-metil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1*H*-pirazol-3-ona; nematocidas tales como aldicarb, aldixcarb, fenamifos, imiciafos y oxamil; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cienopirafen, cihexatin, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin, óxido de fenbutatin,

fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridaben y tebufenpirad; y agentes biológicos incluyendo bacterias entomopatógenas, tales como *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatógenos, tales como el hongo verde de la muscardina; y virus entomopatógenos incluyendo baculovirus, nucleopolihedrovirus (NPV) tales como HzNPV, AfNPV; y virus de la granulosis (GV) tales como CpGV.

Los compuestos de esta invención y composiciones de los mismos se pueden aplicar a plantas transformadas genéticamente para expresar proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados (tales como delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). El efecto de los compuestos fungicidas aplicados de forma exógena de esta invención puede ser sinérgico con las proteínas toxinas expresada.

Referencias generales para protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen The Pesticide Manual, 13ª Edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 y The BioPesticide Manual, 2ª Edición, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

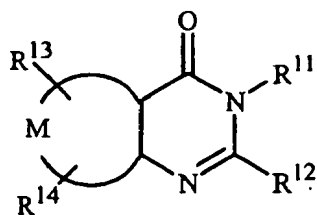
Para realizaciones en donde se usan uno o más de estas diversas parejas de de mezcla, la relación en peso de estas diversas parejas de mezcla (en total) al compuesto de Fórmula 1 está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Cabe destacar las relaciones en peso entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo, relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30: 1). Un experto en la técnica puede determinar con facilidad a través de simple experimentación las cantidades biológicamente eficaces de ingredientes activos necesarias para el espectro deseado de actividad biológica. Resultará evidente que incluir estos componentes adicionales puede ampliar el espectro de enfermedades controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de Fórmula 1 solo.

En ciertos casos, combinaciones de un compuesto de la presente invención con otros compuestos o agentes (es decir, ingredientes activos) biológicamente activos (en particular fungicidas) puede dar lugar a un efecto mayor que el aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable poder reducir la cantidad de agentes químicos liberados en el medio ambiente al tiempo que se asegure un control de las plagas eficaz. Cuando se produce un efecto sinérgico de ingredientes fungicidas activos en dosis de aplicación que proporcionan niveles satisfactorios desde el punto de vista agronómico, tales combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el coste de producción de los cultivos y reducir la carga medioambiental.

Cabe destacar una combinación de un compuesto de Fórmula 1 (en la que R^1 puede ser H) con al menos otro ingrediente fungicida activo. Cabe destacar particularmente dicha combinación en la que el otro ingrediente fungicida activo tiene un sitio de acción distinto al del compuesto de Fórmula 1. En ciertos casos, una combinación con al menos otro ingrediente fungicida activo que tenga un espectro similar de control pero un sitio de acción diferente será particularmente ventajosa para la gestión de la resistencia. Así, una composición de la presente invención puede comprender además una cantidad eficaz desde el punto de vista biológico de al menos un ingrediente fungicida activo adicional que tenga un espectro de control similar pero un sitio de acción diferente.

Cabe destacar particularmente composiciones que, además del compuesto de Fórmula 1 (en la que R^1 puede ser H) incluyen al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en (1) fungicidas de alquilenbis(ditiocarbamato); (2) cimoxanil; (3) fungicidas de fenilamida; (4) fungicidas de pirimidinona; (5) clorotalonil; (6) carboxamidas que actúan en el complejo II del sitio de transferencia de electrones respiratorios de la mitocondrias fúngicas; (7) quinoxifeno; (8) metrafenona; (9) ciflufenamid; (10) ciprodinil; (11) compuestos de cobre; (12) fungicidas de ftalimida; (13) fosetil-aluminio; (14) fungicidas de bencimidazol; (15) ciazofamid; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomicina; (20) fungicidas de diclorofenil dicarboximida; (21) zoxamida; (22) fluopicolida; (23) mandipropamid; (24) amidas de ácido carboxílico que actúan sobre la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición sobre la pared celular; (25) dimetomorf; (26) inhibidores de la biosíntesis de esteroides no-DMI; (27) inhibidores de desmetilasa en la biosíntesis de esteroides; (28) fungicidas del complejo bc_1 ; y sales de los compuestos (1) a (28).

A continuación se proporcionan otras descripciones de clases de compuestos fungicidas. Fungicidas de pirimidinona (grupo (4)) incluyen compuestos de Fórmula A1



A1

en la que M forma un anillo de fenilo, tiofeno o piridina condensado; R¹¹ es alquilo C₁-C₆; R¹² es alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; R¹³ es halógeno; y R¹⁴ es hidrógeno o halógeno.

En la publicación de solicitud de patente PCT WO 94/26722 y en las patentes de Estados Unidos 6,066,638, 6,245,770, 6,262,058 y 6,277,858 se describen fungicidas de pirimidinona. Cabe destacar fungicidas de pirimidinona seleccionados del grupo: 6-bromo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona, 6,8-diiodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona, 6-yodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona (proquinazid), 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona y 3-(ciclopropilmetil)-6-yodo-2-(propiltio)pirido-[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

Los inhibidores de la biosíntesis de esterol (grupo 27)) controlan los hongos inhibiendo enzimas en la ruta de la biosíntesis de esterol. Los fungicidas inhibidores de desmetilasa tienen un sitio de acción común dentro de la ruta fúngica de biosíntesis de esteroides, que implica la inhibición de la desmetilación en la posición 14 del lanosterol o el 24-metilendihidrolanosterol, que son precursores de esteroides en hongos. Los compuestos que actúan en este sitio a menudo se denominan inhibidores de desmetilasa, fungicidas DMI o DMI. La enzima desmetilasa a veces se denomina mediante otros nombres en la bibliografía bioquímica, incluyendo citocromo P-450 (14DM). La enzima desmetilasa se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 y las referencias citadas allí. Los fungicidas DMI se dividen entre varias clases químicas: azoles (incluyendo triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluyendo diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalil, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han mostrado que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI, según se describe por K. H. Kuck et ál. en Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.

Los fungicidas del complejo bc₁ (grupo 28) tienen un modo de acción fungicida que inhibe el complejo bc₁ en la cadena de la respiración de la mitocondria. El complejo bc₁ se denomina a veces mediante otros nombres en la bibliografía bioquímica, incluyendo complejo III de la cadena de transferencia de electrones y ubihidroquinona:citocromo c oxidoreductasa. Este complejo es identificado individualmente por el número de la Enzyme Commission EC1.10.2.2. El complejo bc₁ se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-48; Methods Enzymol. 1986, 126, 253-71; y referencias citadas en este documento. Se sabe que los fungicidas de estrobilurina tales como azoxiestrobina, dimoxiestrobina, enestrobina (SYP-Z071), fluoxaestrobina, kresoxim-metilo, metominoestrobina, orisaestrobina, picoxiestrobina, piraclostrobina y trifloxistrobina tienen este modo de acción (H. Sauter et al., Angew. Chem. Int. Ed. 1999, 38, 1328-1349). Otros compuestos fungicidas que inhiben el complejo bc₁ en la cadena de respiración mitocondrial incluyen famoxadona y fenamidona.

Alquilenbis(ditiocarbamato)s (grupo (1)) incluyen compuestos tales como mancozeb, maneb, propineb y zineb. Fenilamidas (grupo (3)) incluyen compuestos tales como metalaxil, benalaxil, furalaxil y oxadixil. Carboxamidas (grupo (6)) incluyen compuestos tales como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxin, tifluzamida, pentiopirad y N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (publicación de patente PCT WO 2003/010149), y se conocen por inhibir la función mitocondrial alterando el complejo II (succinato deshidrogenasa) en la cadena de transporte de electrones respiratoria. Compuestos de cobre (grupo (11)) incluyen compuestos tales como oxiclورو de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, incluyendo composiciones tales como mezcla Bordeaux (sulfato de cobre tribásico). Ftalimidas (grupo (12)) incluyen compuestos tales como folpet y captan. Fungicidas de bencimidazol (grupo (14)) incluyen benomil y carbendazim. Fungicidas de diclorofenil dicarboximida (grupo (20)) incluyen clozolinato, diclozolina, iprodiona, isovallediona, miclozolin, procimidona y vinclozolin.

Inhibidores de la biosíntesis de esterol no-DMI (grupo (26)) incluyen fungicidas de morfolina y piperidina. Las morfolininas y piperidininas son inhibidores de la biosíntesis de esterol que han mostrado inhibir etapas en la ruta de la biosíntesis de esterol en un punto ulterior al de las inhibiciones conseguidas por la biosíntesis de esterol DMI (grupo (27)). Las morfolininas incluyen aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidininas incluyen fenpropidina.

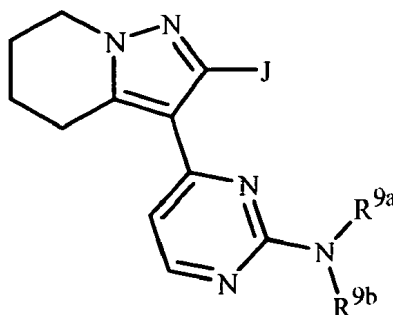
Para un mejor control de enfermedades de plantas causadas por patógenos fungicidas de plantas (por ejemplo, menor dosis de uso o un mayor espectro de los patógenos de plantas controlados) o una gestión de la resistencia se prefieren mezclas de un compuesto de la presente invención con un fungicida seleccionado del grupo seleccionado de ciproconazol, azoxiestrobina boscalid, clorotalonil, epoxiconazol, fluoxaestrobina pentiopirad, quinoxifeno, protioconazol, picoxiestrobina metrafenona, tebuconazol, piraclostrobina proquinazid, ciprodinil, fenpropimorf, famoxadona y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina.

Mezclas preferidas de forma específica (los números de compuesto se refieren a los compuestos en las Tablas de Índice A-F) se seleccionan del grupo: compuesto 8 y ciproconazol; compuesto 109 y ciproconazol; compuesto 107 y ciproconazol; compuesto 108 y ciproconazol; compuesto 5 y ciproconazol; compuesto 12 y ciproconazol; compuesto 26 y ciproconazol; compuesto 27 y ciproconazol; compuesto 54 y ciproconazol; compuesto 116 y ciproconazol; compuesto 117 y ciproconazol; compuesto 121 y ciproconazol; compuesto 8 y azoxistrobina; compuesto 109 y azoxistrobina; compuesto 107 y azoxistrobina; compuesto 108 y azoxistrobina; compuesto 5 y azoxistrobina; compuesto 12 y azoxistrobina; compuesto 26 y azoxistrobina; compuesto 27 y azoxistrobina; compuesto 54 y azoxistrobina; compuesto 116 y azoxistrobina; compuesto 117 y azoxistrobina; compuesto 121 y azoxistrobina; compuesto 8 y boscalid; compuesto 109 y boscalid; compuesto 107 y boscalid; compuesto 108 y boscalid; compuesto 5 y boscalid; compuesto 12 y boscalid; compuesto 26 y boscalid; compuesto 27 y boscalid; compuesto 54 y boscalid; compuesto 116 y boscalid; compuesto 117 y boscalid; compuesto 121 y boscalid; compuesto 8 y clorotalonil; compuesto 109 y clorotalonil; compuesto 107 y clorotalonil; compuesto 108 y clorotalonil; compuesto 5 y clorotalonil; compuesto 12 y clorotalonil; compuesto 26 y clorotalonil; compuesto 27 y clorotalonil; compuesto 54 y clorotalonil; compuesto 116 y clorotalonil; compuesto 117 y clorotalonil; compuesto 121 y clorotalonil; compuesto 8 y epoxiconazol; compuesto 109 y epoxiconazol; compuesto 107 y epoxiconazol; compuesto 108 y epoxiconazol; compuesto 5 y epoxiconazol; compuesto 12 y epoxiconazol; compuesto 26 y epoxiconazol; compuesto 27 y epoxiconazol; compuesto 54 y epoxiconazol; compuesto 116 y epoxiconazol; compuesto 117 y epoxiconazol; compuesto 121 y epoxiconazol; compuesto 8 y fluoxastrobina; compuesto 109 y fluoxastrobina; compuesto 107 y fluoxastrobina; compuesto 108 y fluoxastrobina; compuesto 5 y fluoxastrobina; compuesto 12 y fluoxastrobina; compuesto 26 y fluoxastrobina; compuesto 27 y fluoxastrobina; compuesto 54 y fluoxastrobina; compuesto 116 y fluoxastrobina; compuesto 117 y fluoxastrobina; compuesto 121 y fluoxastrobina; compuesto 8 y pentiopirad; compuesto 109 y pentiopirad; compuesto 107 y pentiopirad; compuesto 108 y pentiopirad; compuesto 5 y pentiopirad; compuesto 12 y pentiopirad; compuesto 26 y pentiopirad; compuesto 27 y pentiopirad; compuesto 54 y pentiopirad; compuesto 116 y pentiopirad; compuesto 117 y pentiopirad; compuesto 121 y pentiopirad; compuesto 8 y quinoxifeno; compuesto 109 y quinoxifeno; compuesto 107 y quinoxifeno; compuesto 108 y quinoxifeno; compuesto 5 y quinoxifeno; compuesto 12 y quinoxifeno; compuesto 26 y quinoxifeno; compuesto 27 y quinoxifeno; compuesto 54 y quinoxifeno; compuesto 116 y quinoxifeno; compuesto 117 y quinoxifeno; compuesto 121 y quinoxifeno; compuesto 8 y protioconazol; compuesto 109 y protioconazol; compuesto 107 y protioconazol; compuesto 108 y protioconazol; compuesto 5 y protioconazol; compuesto 12 y protioconazol; compuesto 26 y protioconazol; compuesto 27 y protioconazol; compuesto 54 y protioconazol; compuesto 116 y protioconazol; compuesto 117 y protioconazol; compuesto 121 y protioconazol; compuesto 8 y picoxistrobina; compuesto 109 y picoxistrobina; compuesto 107 y picoxistrobina; compuesto 108 y picoxistrobina; compuesto 5 y picoxistrobina; compuesto 12 y picoxistrobina; compuesto 26 y picoxistrobina; compuesto 27 y picoxistrobina; compuesto 54 y picoxistrobina; compuesto 116 y picoxistrobina; compuesto 117 y picoxistrobina; compuesto 121 y picoxistrobina; compuesto 8 y metrafenona; compuesto 109 y metrafenona; compuesto 107 y metrafenona; compuesto 108 y metrafenona; compuesto 5 y metrafenona; compuesto 12 y metrafenona; compuesto 26 y metrafenona; compuesto 27 y metrafenona; compuesto 54 y metrafenona; compuesto 116 y metrafenona; compuesto 117 y metrafenona; compuesto 121 y metrafenona; compuesto 8 y tebuconazol; compuesto 109 y tebuconazol; compuesto 107 y tebuconazol; compuesto 108 y tebuconazol; compuesto 5 y tebuconazol; compuesto 12 y tebuconazol; compuesto 26 y tebuconazol; compuesto 27 y tebuconazol; compuesto 54 y tebuconazol; compuesto 116 y tebuconazol; compuesto 117 y tebuconazol; compuesto 121 y tebuconazol; compuesto 8 y piraclostrobina; compuesto 109 y piraclostrobina; compuesto 107 y piraclostrobina; compuesto 108 y piraclostrobina; compuesto 5 y piraclostrobina; compuesto 12 y piraclostrobina; compuesto 26 y piraclostrobina; compuesto 27 y piraclostrobina; compuesto 54 y piraclostrobina; compuesto 116 y piraclostrobina; compuesto 117 y piraclostrobina; compuesto 121 y piraclostrobina; compuesto 8 y proquinazid; compuesto 109 y proquinazid; compuesto 107 y proquinazid; compuesto 108 y proquinazid; compuesto 5 y proquinazid; compuesto 12 y proquinazid; compuesto 26 y proquinazid; compuesto 27 y proquinazid; compuesto 54 y proquinazid; compuesto 116 y proquinazid; compuesto 117 y proquinazid; compuesto 121 y proquinazid; compuesto 8 y ciprodinil; compuesto 109 y ciprodinil; compuesto 107 y ciprodinil; compuesto 108 y ciprodinil; compuesto 5 y ciprodinil; compuesto 12 y ciprodinil; compuesto 26 y ciprodinil; compuesto 27 y ciprodinil; compuesto 54 y ciprodinil; compuesto 116 y ciprodinil; compuesto 117 y ciprodinil; compuesto 121 y ciprodinil; compuesto 8 y fenpropimorf; compuesto 109 y fenpropimorf; compuesto 107 y fenpropimorf; compuesto 108 y fenpropimorf; compuesto 5 y fenpropimorf; compuesto 12 y fenpropimorf; compuesto 26 y fenpropimorf; compuesto 27 y fenpropimorf; compuesto 54 y fenpropimorf; compuesto 116 y fenpropimorf; compuesto 117 y fenpropimorf; compuesto 121 y fenpropimorf; compuesto 8 y famoxadona; compuesto 109 y famoxadona; compuesto 107 y famoxadona; compuesto 108 y famoxadona; compuesto 5 y famoxadona; compuesto 12 y famoxadona; compuesto 26 y famoxadona; compuesto 27 y famoxadona; compuesto 54 y famoxadona; compuesto 116 y famoxadona; compuesto 117 y famoxadona; compuesto 121 y famoxadona; compuesto 8 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 109 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 107 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 108 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 5 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 12 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 26 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 27 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 54 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 116 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 117 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 121 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina.

1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina; compuesto 121 y 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina;

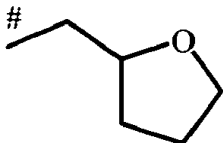
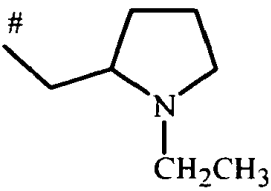
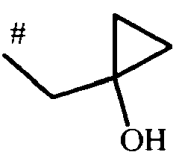
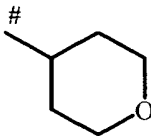
Los siguientes Ensayos demuestran la eficacia de control de los compuestos de la presente invención sobre patógenos específicos. Sin embargo, la protección por control de patógenos proporcionada por los compuestos no queda limitada a estas especies. Véanse las Tablas de Índice A-F para las descripciones de compuestos de Fórmula 1 y la Tabla de Índice G para las descripciones de compuestos de Fórmula 1a. En las Tablas de Índices que se muestran a continuación se usan las siguientes abreviaturas: *t* es terciario, *s* es secundario, *n* es normal, *i* es iso, *c* es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, *i*-Pr es isopropilo, Bu es butilo, *c*-Pr es ciclopropilo, *c*-Bu es ciclobutilo, *t*-Bu es *terc*-butilo, Ph es fenilo, OMe es metoxi y SO₂ es sulfonilo. "(HCl)" en la columna R^{9b} significa sal de cloruro de hidrógeno. (*R*) o (*S*) denota la quiralidad absoluta del centro de carbono asimétrico. La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y va seguida de un número que indica en qué ejemplo se prepara el compuesto.

TABLA DE ÍNDICE A

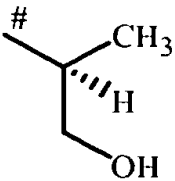
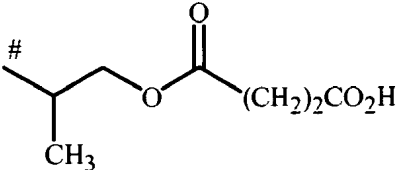
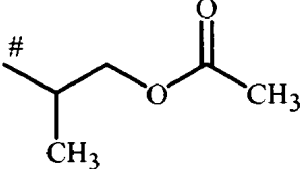
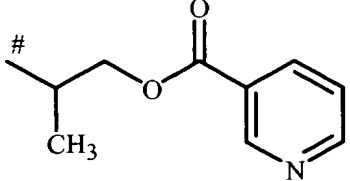
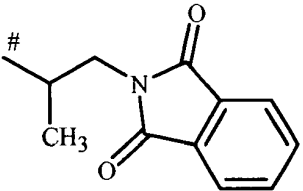
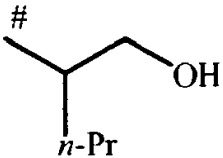


Comp. n°	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
1	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
2	4-F-Ph	<i>s</i> -Bu	H	144-145
3	4-F-Ph	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	173-174
4	4-F-Ph	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃	H	*
5	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	191-192
6	4-F-Ph	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	140-141
7	4-F-Ph	ciclopentilo	H	161-163
8 (Ej. 2)	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	178-180
9 ^a	4-F-Ph	4-(<i>s</i> -Bu)-Ph	H	110-112
10	4-F-Ph	H	H	232-235
11	4-F-Ph	<i>n</i> -Pr	H	128-129
12	4-F-Ph	ciclopropilo	H	164-165
13	4-F-Ph	CH ₃	H	156-158
14	4-F-Ph	CH ₃	CH ₃	157-158
15	4-F-Ph	CH ₂ CH=CH ₂	H	133-134
16	4-F-Ph	CH ₂ CH ₂ NH ₂	H	175-176
17	4-F-Ph	CH ₂ C≡CH	H	165-166
18	4-F-Ph	CH ₂ CH ₃	H	158-159
19	4-F-Ph	(<i>R</i>)- <i>s</i> -Bu	H	137-140
20	4-F-Ph	(<i>S</i>)- <i>s</i> -Bu	H	*
21	4-Cl-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
22	4-Cl-Ph	ciclopropilo	H	169-170
23	4-F-Ph	N(CH ₃) ₂	H	158-159
24 (Ej. 1)	4-F-Ph	CH ₂ -ciclopropilo	H	124-125

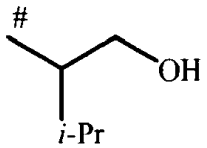
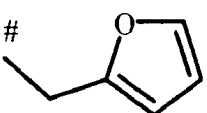
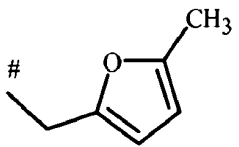
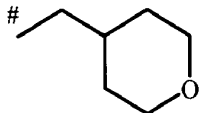
(continuación)

Comp. n°	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
25	4-F-Ph	CH ₂ CH ₂ OH	H	181-182
26	Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
27	Ph	ciclopropilo	H	*
28	2,4-di-F-Ph	ciclopropilo	H	*
29	4-F-Ph	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	140-141
30	4-F-Ph	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OH		155-157
31	4-F-Ph	CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OH	H	168-170
32	3-Me-4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	*
33	3-Me-4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
34 ^a	4-F-Ph		H	129-131
35	4-F-Ph	CH ₂ Si(CH ₃) ₃		124-125
36	2-F-Ph	<i>i</i> -Pr		*
37	4-F-Ph	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	H	*
38	2-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	*
39	4-F-Ph	CH ₂ -2-tienilo	H	153-155
40	4-F-Ph	4-F-Ph	H	177-178
41 ^a	4-F-Ph		H	*
42	3-tienilo	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	*
43	3-tienilo	<i>i</i> -Pr	H	*
44 ^a	4-F-Ph		H	157-159
45	2-Me-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
46	2-Me-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	*
47	4-F-Ph	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	155-156
48	4-F-Ph	(<i>S</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	159-160
49 ^a	4-F-Ph		H	200-202
50	3-Me-4-F-Ph	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	H	133-136
51 (Ej. 2)	4-F-Ph	ciclobutilo	H	155-157
52 (Ej. 2)	4-F-Ph	C(O)CH ₃	H	*
53	Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*

(continuación)

Comp. n°	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
54 ^a	Ph		H	151-154
55	Ph	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	H	*
56	3-Me-4-F-Ph	ciclopropilo	H	143-144
57	4-F-Ph	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	162-163
58	4-F-Ph	CH ₂ C≡CH	H	145-150
59	Ph	CH ₂ C≡CH	H	168-169
60	4-F-Ph	4-OCF ₃ -Ph	H	*
61	3-tienilo	ciclopropilo	H	*
62	3-Me-4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
63	4-F-Ph	CH(CH ₂ OH) ₂	H	174-177
64	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₃ ⁻ Na ⁺	H	176-179
65	4-F-Ph	OMe	H	*
66 ^a	4-F-Ph		H	194-196
67 ^a	4-F-Ph		H	164-165
68 ^a	4-F-Ph		H	131-133
69	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H(HCl)	149-150
70	4-F-Ph	CH ₃	NH ₂	*
71 ^a	4-F-Ph		H	*
72	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H(HCl)	128-130
73 ^a	4-F-Ph		H	137-139

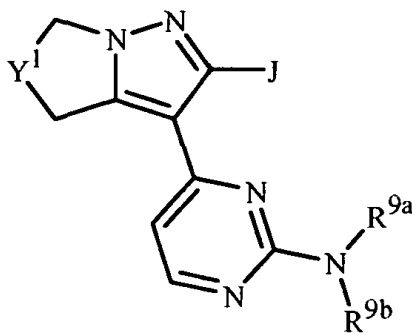
(continuación)

Comp. n°	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
74 ^a	4-F-Ph		H	139-140
75	4-F-Ph	O-CH ₂ -C-Bu	H	*
77	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	*
78 ^a	4-F-Ph		H	160-162
79 ^a	4-F-Ph		H	155-156
80 ^a	4-F-Ph		H	148-150
81	4-F-Ph	-CH ₂ CH(CH ₃)-		*
82	4-F-Ph	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		128-130
142	Ph	CH ₃	H	*
143	Ph	CH ₂ CH ₃	H	*
179	Ph	<i>n</i> -Pr	H	*
180	3-tienilo	ciclopropilo	H	157-158
181	3-Me-Ph	ciclopropilo	H	162-164
182	Ph	4-fluoro-3-metoxifenilo	H	*
185	3-Me-Ph	<i>n</i> -Pr	H	112-115
186	3-Me-Ph	CH ₂ CH ₃	H	145-149
187	3-Me-Ph	CH ₃	H	*

^a El enlace que se identifica con "#" esta conectado al átomo de nitrógeno unido a R^{9a}.

*Véase la Tabla de Índice H para los datos de RMN de ¹H

TABLA DE ÍNDICE B



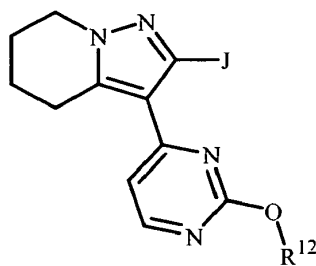
Comp. n°	Y ¹	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
83 (Ej. 8)	S	2,4-di-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
84	CH ₂	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*

(continuación)

85	CH2	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	*
86	CH2	4-OMe-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
87	CH2	2,4-di-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	*
88	CH2	2,4-di-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
89	CH2	4-Me-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
90	CH2	4-F-Ph	CH ₃	H	*
91	CH2	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
92	CH2	4-F-Ph	ciclopropilo	H	*
93	CH2	4-OMe-Ph	ciclopropilo	H	*
94	CH2	2,4-di-F-Ph	ciclopropilo	H	*
95	CH2	4-F-Ph	CH ₂ CH=CH ₂	H	*
96	CH2	2-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
97	CH2	2-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
98	CH2	2-F-Ph	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	*
99	CH2	2-F-Ph	ciclopropilo	H	*
100	CH2	3-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	*
101	CH2	3-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	*
102	CH2	3-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
103	CH2	3-F-Ph	ciclopropilo	H	*
104	CH2	3,5-di-F-Ph	ciclopropilo	H	*

*Véase la Tabla de Índice H para los datos de RMN de ¹H

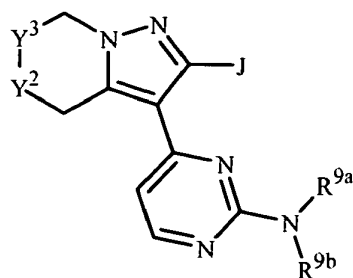
TABLA DE ÍNDICE C



Comp. n°	J	R ¹²	p.f. (°C)
105	4-F-Ph	CH ₃	103-104
106 ^b	4-F-Ph		179-190

^b El enlace que está identificado con "#" está conectado al átomo de oxígeno unido a R¹².

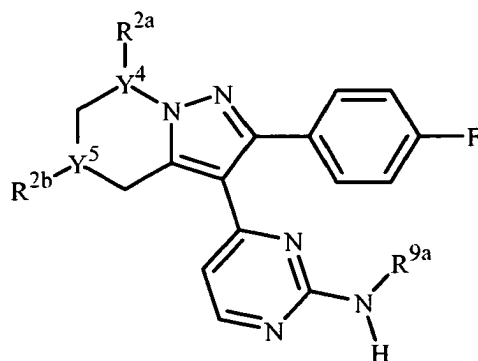
TABLA DE ÍNDICE D



Comp. nº	Y ²	Y ³	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
107	O	CH ₂	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	144-146
108	O	CH ₂	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	124-126
109	O	CH ₂	4-F-Ph	ciclopropilo	H	*
110	S	CH ₂	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	172-175
111	S	CH ₂	4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	182-184
112 (Ej. 7)	CH ₂	O	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	167-169
113	CH ₂	O	4-F-Ph	(<i>R</i>)- CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	*
114 (Ej. 9)	S(O) ₂	CH ₂	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	*
115	S(O) ₂	CH ₂	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	OH	*
116	O	CH ₂	Ph	<i>i</i> -Pr	H	185-187
117	O	CH ₂	Ph	ciclopropilo	H	186-189
118	O	CH ₂	3-tienilo	<i>i</i> -Pr	H	177-179
119	O	CH ₂	3-Me-4-F-Ph	ciclopropilo	H	191-193
120	O	CH ₂	3-Me-4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	119-122
121	O	CH ₂	3-tienilo	ciclopropilo	H	182-184
122	O	CH ₂	Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	196-199
123	O	CH ₂	3-Me-4-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	194-197
124	O	CH ₂	3-tienilo	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	193-194
125	O	CH ₂	2,4-di-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H	151-153
126	O	CH ₃	2,4-di-F-Ph	ciclopropilo	H	229-230
127	O	CH ₂	2,4-di-F-Ph	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	157-160
128 ^c	O	CH ₂	4-F-Ph	<i>i</i> -Pr	H(HCl)	*
129 ^d	O	CH ₂	4-F-Ph	# 	H	*
183	O	CH ₂	Ph	CH ₂ CH ₃	H	174-176
Comp. nº	Y ²	Y ³	J	R ^{9a}	R ^{9b}	p.f. (°C)
184	O	CH ₂	Ph	n-Pr	H	186-188

^c El Compuesto 128 es una sal de cloruro de hidrógeno.^d El enlace que se identifica con "#" esta conectado al átomo de nitrógeno unido a R^{9a}.*Véase la Tabla de Índice H para los datos de RMN de ¹H

TABLA DE ÍNDICE E

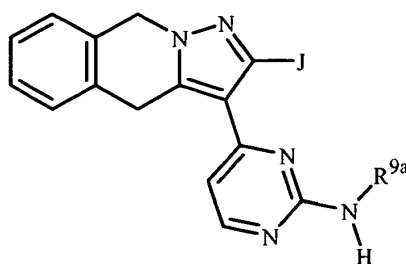


Comp. nº	Y ⁴	Y ⁵	R ^{9a}	R ^{2a}	R ^{2b}	p.f. (°C)
130	C	N	<i>i</i> -Pr	H ₂	C(O)CH ₃	*
131 (Ej. 4)	N	C	ciclopropilo	H	H ₂	184-187
132 (Ej. 5)	N	C	CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	H ₂	165-167
133	C	N	<i>i</i> -Pr	H ₂	H ₂ +Cl ⁻	*
134 (Ej. 4)	N	C	ciclopropilo	C(O)CH ₃	H ₂	*
135 (Ej. 6)	N	C	ciclopropilo	CH ₃	H ₂	*
136	N	C	<i>i</i> -Pr	H	H ₂	145-147
137	N	N	ciclopropilo	CH ₂ CH=CH ₂	H	133-134
138 (Ej. 3)	C	N	H	H ₂	C(O)OCH ₃	88-89
139 ^e	N	C		C(O)CH ₃	H ₂	133-135
141 (Ej. 3)	C	N	<i>i</i> -Pr	H ₂	H	*

^e El enlace que se identifica con "#" esta conectado al átomo de nitrógeno unido a R^{9a}.

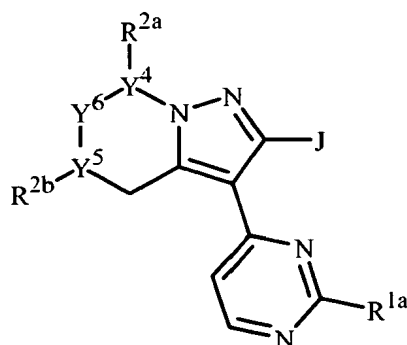
*Véase la Tabla de Índice H para los datos de RMN de ¹H

TABLA DE ÍNDICE F



Comp. nº	J	R ^{9a}	p.f. (°C)
140	4-F-Ph	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	210-214

TABLA DE ÍNDICE G



Comp. n°	Y ⁴	Y ⁵	Y ⁶	R ^{2b}	R ^{2a}	J	R ^{1a}	p.f. (°C)
144	N	C	CH ₂	H ₂	C(O)OCH ₂ -Ph	4-F-Ph	Cl	115-120
145 (Ej. 6)	N	C	CH ₂	H ₂	H	4-F-Ph	Cl	206-207
146	N	C	CH ₂	H ₂	CH ₂ CH=CH ₂	4-F-Ph	Cl	97-99
147	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	<i>t</i> -butilo	Cl	*
148	N	C	CH ₂	H ₂	C(O)CF ₃	4-F-Ph	Cl	*
149	N	C	CH ₂	H ₂	C(O)OCH ₂ -Ph	Ph	Cl	64-67
150 (Ej. 2)	C	C	CH ₂ CH ₂	H ₂ H ₂	H ₂	4-F-Ph	Cl	*
151	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2,4-di-F-Ph	Cl	*
152	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2-Cl-Ph	Cl	*
153	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	Ph	Cl	*
154	C	S	CH ₂	-	H ₂	4-F-Ph	Cl	*
155	C	N	CH ₂	C(O)OCH ₂ Ph	H ₂	4-F-Ph	Cl	*
156	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	4-Me ₂ N-Ph	Cl	*
157	N	C	CH ₂	H ₂	C(O)NHCH ₃	4-F-Ph	Cl	74-77
158	N	C	CH ₂	H ₂	C(O)NH ₂	4-F-Ph	Cl	90-93
159	N	C	CH ₂	H ₂	C(O)N(CH ₃) ₂	4-F-Ph	Cl	190-194
160	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	4-OCH ₃ -Ph	SO ₂ CH ₃	*
161	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	4-Cl-Ph	SC ₂ CH ₃	*
162	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	4-F-3-CH ₃ -Ph	SO ₂ CH ₃	*
163	C	O	CH ₂		H ₂	4-F-Ph	SO ₂ CH ₃	*
164	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2-F-Ph	SO ₂ CH ₃	*
165	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	1-naftalenilo	SO ₂ CH ₃	*
166	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2-CF ₃ -Ph	SO ₂ CH ₃	*
168	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	3-tienilo	SO ₂ CH ₃	*
169	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2-CH ₃ -Ph	SO ₂ CH ₃	*
170	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2-CF ₃ -Ph	SO ₂ CH ₃	*
171	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	1-CH ₃ -imidazol-5-ilo	SO ₂ CH ₃	*
172	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	3-F-Ph	SO ₂ CH ₃	*

(continuación)

Comp. n°	Y ⁴	Y ⁵	Y ⁶	R ^{2b}	R ^{2a}	J	R ^{1a}	p.f. (°C)
173	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	3,5-di-F-Ph	SO ₂ CH ₃	*
174 (Ej. 1)	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	4-F-Ph	SO ₂ CH ₃	*
175	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	3-Cl-Ph	SO ₂ CH ₃	*
176	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	2-tienilo	SO ₂ CH ₃	*
177	C	C	CH ₂	H ₂	H ₂	3-CH ₃ -Ph	SO ₂ CH ₃	*
178 (Ej. 7)	C	C	O	H ₂	H ₂	4-F-Ph	SO ₂ CH ₃	*

*Véase la Tabla de Índice H para los datos de RMN de ¹H

TABLA DE ÍNDICE H

Comp. n°	Datos de RMN de ¹ H (solución de CDCl ₃ a menos que se indique lo contrario) ^a
1	δ 8,15 (m, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,23 (m, 1H), 5,15 (d, 1H), 4,22 (m, 3H), 3,40 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,12 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 1,93 (m, 2H), 1,25 (d, 3H).
4	δ 8,03 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,04 (t, 2H), 6,21 (d, 1H), 4,99 (d, 1H), 4,21 (t, 2H), 4,02 (m, 2H), 3,12 (t, 1H), 2,09 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,45 (m, 4H), 1,18 (d, 3H), 0,91 (t, 3H).
20	δ 8,02 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,04 (t, 2H), 6,21 (d, 1H), 5,13 (m, 1H), 4,22 (t, 2H), 3,95 (m, 1H), 3,11 (t, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,54 (m, 2H), 1,18 (d, 3H), 0,91 (t, 3H).
21	δ 8,04 (d, 1H), 7,44 (m, 2H), 7,32 (m, 2H), 6,23 (d, 1H), 4,94 (d, 1H), 4,22 (m, 2H), 4,11 (m, 1H), 3,10 (m, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,92 (m, 2H), 1,22 (d, 6H).
24	δ 8,05 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,04 (t, 2H), 6,24 (d, 1H), 5,31 (m, 1H), 4,22 (t, 2H), 3,23 (1, 2H), 3,11 (t, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,06 (m, 1H), 0,51 (m, 2H), 0,23 (m, 2H).
26	δ 8,00 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,34 (m, 3H), 6,23 (d, 1H), 4,83 (d, 1H), 4,23 (m, 2H), 4,13 (m, 1H), 3,13 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 1,92 (m, 2H), 1,23 (m, 6H).
27	δ 8,06 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,35 (m, 3H), 6,31 (d, 1H), 5,22 (s ancho, 1H), 4,23 (m, 2H), 3,18 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 2,09 (m, 2H), 1,92 (m, 2H), 0,79 (m, 2H), 0,56 (m, 2H).
28	δ 8,09 (d, 1H), 7,49 (m, 1H), 6,94 (m, 1H), 6,82 (m, 1H), 6,23 (d, 1H), 5,16 (s ancho, 1H), 4,24 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 2,70 (m, 1H), 2,11 (m, 2H), 1,93 (m, 2H), 0,73 (m, 2H), 0,52 (m, 2H).
32	δ 7,99 (d, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,22 (m, 1H), 6,96 (m, 1H), 6,25 (d, 1H), 5,48 (d, 1H), 4,20 (m, 2H), 4,09 (m, 1H), 3,70 (m, 1H), 3,60 (m, 1H), 3,10 (m, 2H), 2,27 (m, 3H), 2,08 (m, 2H), 1,89 (m, 2H), 1,24 (d, 3H).
33	δ 8,01 (d, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,23 (m, 1H), 6,97 (m, 1H), 6,23 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 4,21 (m, 2H), 4,12 (m, 1H), 3,13 (m, 2H), 2,27 (m, 3H), 2,08 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,22 (d, 6H).
36	δ 8,00 (d, 1H), 7,49 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,08 (m, 1H), 6,17 (d, 1H), 4,97 (d, 1H), 4,24 (m, 2H), 4,01 (m, 1H), 3,18 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 1,93 (m, 2H), 1,17 (d, 6H).
38	δ 7,99 (d, 1H), 7,49 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,07 (m, 1H), 6,22 (d, 1H), 5,22 (d, 1H), 4,23 (m, 2H), 3,95 (m, 1H), 3,64 (m, 1H), 3,52 (m, 1H), 3,14 (m, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,92 (m, 2H), 1,17 (d, 3H).
41	δ 8,04 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,04 (t, 2H), 6,22 (d, 1H), 5,6 (m, 1H), 4,21 (t, 2H), 3,6 (ancho, 2H), 3,25 (s ancho, 2H), 3,11 (t, 2H), 2,87 (m, 1H), 2,64 (m, 1H), 2,33 (ancho, 2H), 2,10 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,74 (m, 2H), 1,12 (t, 3H).
42	δ 8,04 (d, 1H), 7,44 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 6,39 (d, 1H), 5,33 (d, 1H), 4,19 (m, 2H), 4,11 (m, 1H), 3,72 (m, 1H), 3,59 (m, 1H), 3,06 (m, 2H), 2,07 (m, 2H), 1,88 (m, 2H), 1,25 (m, 3H).
43	δ 8,06 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,21 (m, 1H), 6,35 (d, 1H), 5,16 (s, 1H), 4,20 (m, 2H), 4,14 (m, 1H), 3,10 (m, 2H), 2,08 (m, 2H), 1,90 (m, 2H), 1,24 (d, 6H).
45	δ 7,86 (d, 1H), 7,25 (m, 2H), 7,18 (m, 2H), 5,94 (d, 1H), 4,98 (d, 1H), 4,19 (m, 2H), 4,04 (m, 1H), 3,23 (m, 2H), 2,09 (m, 3H), 2,05 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,17 (d, 6H).
46	δ 7,88 (d, 1H), 7,29 (m, 2H), 7,22 (m, 2H), 6,03 (d, 1H), 5,13 (d, 1H), 4,22 (m, 2H), 4,01 (m, 1H), 3,67 (m, 1H), 3,54 (m, 1H), 3,22 (m, 2H), 2,11 (m, 5H), 1,94 (m, 2H), 1,20 (m, 3 H).

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Datos de RMN de ^1H (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
51	δ 8,26 (d, 1H), 7,43 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 6,82 (d, 1H), 5,27 (d, 1H), 4,41 (m, 1H), 4,21 (t, 2H), 3,11 (t, 2H), 2,36 (m, 2H), 2,09 (m, 2H), 1,92 (m, 4H), 1,72 (m, 2H).
52	δ 8,3 (d, 1H), 8,04 (s ancho, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,67 (d, 1H), 4,26 (m, 2H), 3,17 (m, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
53	δ 8,00 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,34 (m, 3H), 6,24 (d, 1H), 5,48 (d, 1H), 4,22 (m, 3H), 3,45 (m, 1H), 3,37 (m, 4H), 3,13 (m, 2H), 2,06 (m, 2H), 1,89 (m, 2H), 1,24 (m, 3H).
55	δ 7,91 (d, 1H), 7,39 (m, 2H), 7,21 (m, 3H), 6,12 (d, 1H), 4,86 (m, 1H), 4,10 (m, 2H), 3,01 (m, 2H), 2,74 (m, 2H), 1,96 (m, 2H), 1,79 (m, 2H), 0,00 (s, 9H).
61	δ 8,13 (d, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,23 (m, 1H), 6,43 (m, 1H), 5,64 (s ancho, 1H), 4,20 (m, 2H), 3,14 (m, 2H), 2,78 (m, 1H), 2,07 (m, 2H), 1,89 (m, 2H), 0,77 (m, 2H), 0,55 (m, 2H).
62	δ 8,03 (d, 1H), 7,38 (m, 1H), 7,25 (m, 1H), 6,97 (m, 1H), 6,25 (d, 1H), 5,67 (s ancho, 1H), 4,21 (m, 3H), 3,46 (m, 1H), 3,36 (m, 4H), 3,13 (m, 2H), 2,27 (m, 3 H), 2,07 (m, 2H), 1,89 (m, 2H), 1,24 (m, 3 H).
70	δ 8,12 (d, 1H), 7,43 (dd, 2H), 7,05 (1, 2H), 6,22 (d, 1H), 4,38 (s ancho, 2H), 4,22 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,13 (t, 2H), 2,11 (m, 2H), 1,92 (m, 2H).
71	δ 7,88 (d, 1H), 7,69 (m, 2H), 7,58 (d, 2H), 7,25 (m, 2H), 6,98 (m, 2H), 6,07 (d, 1H), 5,25 (d, 1H), 4,55 (m, 1H), 4,21 (m, 2H), 3,83 (m, 2H), 3,19 (m, 1H), 2,98 (m, 1H), 2,12 (m, 2H), 1,93 (m, 2H), 1,31 (d, 3H).
77	δ 8,04 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,03 (t, 2H), 6,23 (d, 1H), 5,33 (m, H), 4,21 (t, 2H), 4,02 (m, 1H), 3,11 (t, 2H), 2,44 (dd, 1H), 2,25 (m, 7H) 2,09 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,21 (d, 3H).
81	δ 8,23 (d, 2H), 7,44 (dd, 2H), 7,06 (t, 2H), 6,53 (d, 1H), 4,22 (t, 2H), 3,17 (t, 2H), 2,6 (m, 1H), 2,47 (d, 1H), 2,2 (d, 1H), 2,11 (m, 1H), 1,94 (m, 2H), 1,41 (d, 3H).
83	δ 8,03 (d, 1H), 7,47 (m, 1H), 6,99 (m, 1H), 6,91 (m, 1H), 6,12 (dd, 1H), 5,28 (t, 2H), 4,84 (s, 1H), 4,50 (t, 2H), 4,05 (d, 1H), 1,23 (d, 6H).
86	δ 8,00 (d, 1H), 7,46 (m, 2H), 6,96 (m, 2H), 6,33 (d, 1H), 5,19 (d, 1H), 4,21 (m, 3H), 3,84 (s, 3H), 3,49 (m, 1H), 3,37 (m, 4H), 3,22 (m, 2H), 2,65 (m, 2H), 1,25 (m, 3H).
87	δ 8,03 (d, 1H), 7,48 (s, 1H), 6,9 (d, 1H), 6,8 (t, 1H), 6,20 (d, 1H), 4,72 (d, 1H), 4,24 (t, 2H), 3,25 (d, 2H), 2,69 (d, 2H), 1,50 (m, 2H), 1,12 (d, 3H), 0,91 (t, 3H).
88	δ 8,04 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 6,95 (d, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,22 (d, 1H), 5,06 (d, 1H), 4,24 (t, 2H), 3,41 (m, 1H), 3,33 (m, 5H), 3,26 (t, 2H), 2,68 (m, 2H), 1,19 (d, 3H).
89	δ 7,98 (d, 1H), 7,43 (d, 2H), 7,19 (d, 2H), 6,31 (d, 1H), 4,90 (d, 1H), 4,21 (t, 2H), 3,96 (dd, 1H), 3,23 (t, 2H), 2,65 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,52 (m, 2H), 1,19 (d, 3H), 0,95 (t, 3H).
90	δ 8,05 (d, 1H) 7,50 (m, 2H) 7,03 (m, 2H) 6,31 (d, 1H) 5,04 (s, 1H) 4,22 (m, 1H) 3,24 (t, 1H) 2,96 (d, 3H) 2,65 (m, 1H) 2,04 (s, 3H).
91	δ 8,02 (d, 1H), 7,52 (m, 2H), 7,08 (m, 2H), 6,27 (d, 1H), 5,01 (d, 1H), 4,24 (m, 2H), 4,09 (dd, 1H), 3,22 (t, 2H), 2,67 (m, 2H), 1,22 (d, 6H).
92	δ 8,07 (d, 1H), 7,54 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,35 (d, 1H), 5,58 (s, 1H), 4,21 (m, 2H), 3,25 (t, 2H), 2,74 (dd, 1H), 2,66 (m, 2 H), 0,76 (m, 2H), 0,53 (m, 2H).
93	δ 8,05 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 6,92 (m, 2H), 6,39 (d, 1H), 5,36 (s, 1H), 4,21 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,25 (t, 2H), 2,77 (m, 1H), 2,65 (t, 2H), 0,78 (dd, 2H), 0,55 (dd, 2H).
94	δ 8,08 (d, 1H), 7,49 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 6,87 (m, 1H), 6,26 (d, 1H), 5,27 (s, 1H), 4,24 (m, 2H), 3,28 (t, 2H), 2,67 (m, 3H), 0,72 (m, 2H), 0,49 (m, 2H).
95	δ 8,05 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,07 (m, 2H), 6,32 (d, 1H), 5,96 (m, 1H), 5,25 (m, 2H), 5,12 (m, 1H), 4,22 (m, 2H), 4,01 (m, 2H), 3,22 (m, 2H), 2,65 (m, 2H).
96	δ 8,18 (d, 1H), 7,27 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 5,16 (s, 1H), 4,26 (m, 3H), 3,38 (m, 2H), 3,29 (m, 3H), 3,25 (m, 1H), 2,92 (m, 2H), 2,66 (m, 2H), 1,27 (d, 3 H).
97	δ 8,01 (d, 1H), 7,49 (m, 1H), 7,21 (m, 1H), 7,11 (m, 2H), 6,20 (d, 1H), 4,74 (s, 1H), 4,26 (m, 2H), 3,27 (m, 2H), 2,91 (d, 1H), 2,67 (m, 2H), 1,17 (d, 6H).

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Datos de RMN de ^1H (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
98	δ 8,01 (d, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,38 (m, 1H), 7,21 (m, 1H), 7,11 (t, 1H), 6,22 (d, 1H), 4,98 (s, 1H), 4,25 (m, 2H), 3,26 (m, 2H), 3,09 (s, 2H), 2,70 (m, 2H), 1,82 (m, 1H), 0,92 (d, 6H).
99	δ 8,06 (d, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,21 (m, 1H), 7,12 (m, 1H), 6,27 (dd, 1H), 5,13 (s, 1H), 4,25 (m, 2H), 3,30 (t, 2H), 2,70 (m, 3H), 0,72 (m, 2H), 0,51 (m, 2H).
100	δ 8,01 (d, 1H), 7,31 (m, 3H), 7,06 (m, 1H), 6,33 (d, 1H), 5,63 (s, 1H), 4,18 (m, 3H), 3,46 (m, 1H), 3,37 (m, 4H), 3,22 (m, 2H), 2,67 (m, 2H), 1,24 (d, 3H).
101	δ 8,04 (d, 1H), 7,31 (m, 3H), 7,06 (m, 1H), 6,31 (d, 1H), 4,81 (s, 1H), 4,23 (m, 2H), 3,91 (s, 1H), 3,22 (m, 2H), 2,69 (m, 2H), 1,54 (m, 2H), 1,18 (d, 3H), 0,94 (t, 3H).
102	δ 8,04 (d, 1H), 7,31 (m, 3H), 7,05 (m, 1H), 6,31 (d, 1H), 5,21 (s, 1H), 4,20 (m, 2H), 4,09 (m, 1H), 3,21 (t, 2H), 2,66 (m, 2H), 1,20 (d, 6H).
103	δ 8,09 (d, 1H), 7,32 (m, 3H), 7,06 (m, 1H), 6,39 (d, 1H), 5,68 (s, 1H), 4,21 (m, 2H), 3,24 (t, 1H), 2,73 (m, 2H), 2,66 (m, 2H), 0,75 (m, 2H), 0,52 (m, 2H).
109	δ 8,03 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,11 (m, 2H), 6,29 (d, 1H), 5,36 (s, 1H), 5,26 (s, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,16 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 0,83 (m, 2H), 0,58 (m, 2H).
113	δ 8,02 (d, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,07 (m, 2H), 6,25 (d, 1H), 5,59 (s, 2H), 5,34 (d, 1H), 4,10 (m, 4H), 3,71 (m, 1H), 3,58 (m, 1H), 3,28 (m, 2H), 1,25 (m, 3H).
114	δ 8,04 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 7,10 (m, 2H), 6,16 (d, 1H), 5,02 (d, 1H), 4,89(s, 2H), 4,86 (m, 2H), 4,11 (m, 1H), 3,59 (m, 2H), 1,28 (d, 6H).
115	δ 7,67 (d, 1H), 7,39 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,19 (d, 1H), 4,88 (m, 2H), 4,69 (s, 2H), 4,21 (m, 1H), 3,60 (d, 2H), 1,37 (d, 6H).
128	δ 8,60 (s ancho, 1H), 7,78 (s ancho, 1H), 7,39 (s ancho, 2H), 7,19 (s ancho, 2H), 6,35 (s ancho, 1H), 5,20 (s ancho, 2H), 4,28 (m, 5H), 1,39 (s ancho, 6H).
130	δ 8,02 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,10 (m, 2H), 6,20 (m, 1H), 5,16 (m, 2H), 4,97 (d, 1H), 4,32 (m, 1H), 4,26 (m, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,99 (m, 1H), 2,24 (m, 3H), 1,30 (d, 6H).
131	δ 8,08 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,30 (d, 1H), 5,29 (m, 2H), 3,49 (m, 2H), 3,28 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 1,98 (m, 2H), 0,79 (m, 2H), 0,56 (m, 2H).
132	δ 8,01 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,28 (d, 1H), 5,27 (s, 1H), 5,08 (m, 1H), 4,10 (m, 1H), 3,75 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 3,49 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 2,00 (m, 2H), 1,26 (m, 3H).
134	δ 8,13 (d, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,31 (d, 1H), 5,30 (s, 1H), 4,02 (m, 2H), 3,29 (s, 2H), 2,78 (m, 1H), 2,27 (s, 3H), 2,07 (m, 2H), 0,81 (m, 2H), 0,58 (m, 2H).
135	δ 8,13 (d, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,1 (d, 1H), 5,30 (s, 1H), 4,02 (m, 2H), 3,29 (s, 2H), 2,78 (m, 1H), 2,27 (s, 3H), 2,07 (m, 2H), 0,81 (m, 2H), 0,58 (m, 2H).
136	δ 8,02 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,04 (m, 2H), 6,22 (d, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,86 (m, 1H), 3,49 (m, 2H), 3,23 (m, 2H), 1,99 (m, 2H), 1,24 (d, 6H).
137	δ 8,07 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,28 (d, 1H), 6,03 (m, 1H), 5,29 (m, 3H), 4,01 (d, 2H), 3,39 (m, 2H), 3,24 (m, 2H), 2,78 (m, 1H), 1,95 (m, 2H), 0,80 (m, 2H), 0,56 (m, 2H).
138	δ 8,00 (d, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 6,19 (d, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,98 (d, 1H), 4,27 (m, 2H), 4,19 (m, 1H), 4,02 (s ancho, 2H), 3,79 (s, 3H), 1,28 (d, 6H).
139	δ 8,11 (d, 1H), 7,49(m, 2H), 7,09 (m, 2H), 6,30 (d, 1H), 4,99 (s, 1H), 4,01 (m, 4H), 3,48 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,09 (m, 2H), 1,98 (m, 2H), 1,53 (m, 2H).
141	δ 9,35 (s, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,65 (dd, 2H), 7,27 (t, 2H), 5,02 (s, 1H), 4,72 (s, 1H), 4,49 (s, 2H), 4,43(t, 2H), 4,01 (s, 2H), 3,44 (m, 1H), 1,22 (d, 3H), 1,07 (d, 3H).
142	δ 8,03 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,35 (m, 3H), 6,26 (d, 1H), 4,99 (s, 1H), 4,23 (t, 2H), 3,15 (t, 2H), 2,99 (d, 3H), 2,10 (m, 2H), 1,91 (m, 2H).
143	δ 8,00 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,34 (m, 3H), 6,24 (d, 1H), 4,97 (s, 1H), 4,23 (t, 2H), 3,44 (m, 2H), 3,14 (t, 2H), 2,10 (m, 2H), 1,92 (m, 2H), 1,23 (t, 3H).
147	δ 8,53 (d, 1H), 7,18 (d, 1H), 4,13 (m, 2H), 2,72 (m, 2H), 2,05 (m, 2H), 1,85 (m, 2H), 1,35 (s, 9H).
148	δ 8,35 (d, 1H) 7,47 (m, 2H) 7,13 (m, 2H) 6,90 (d, 1H) 4,13 (m, 2H) 3,42 (m, 2H) 2,25 (m, 2H).

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Datos de RMN de ^1H (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
150	δ 8,27 (d, 1H), 7,43 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 6,83 (d, 1H), 4,23 (m, 2H), 3,2 (m, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,96 (m, 2H).
151	δ 8,29 (d, 1H), 7,49 (m, 1H), 7,00 (m, 1H), 6,88 (m, 1H), 6,78 (d, 1H), 4,25 (t, 2H), 3,24 (t, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
152	δ 8,20 (d, 1H), 7,42 (m, 4H), 6,60 (d, 1H), 4,26 (m, 2H), 3,30 (m, 2H), 2,14 (m, 2H), 1,99 (m, 2H).
153	δ 8,22 (d, 1H), 7,43 (m, 5H), 6,84 (d, 1H), 4,24 (m, 2H), 3,22 (m, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,96 (m, 2H).
154	δ 8,29 (d, 1H), 7,42 (m, 2H), 7,12 (m, 2H), 6,84 (d, 1H), 4,49 (m, 2H), 4,32 (s, 2H), 3,15 (m, 2H).
155	δ 8,28 (d, 1H), 7,42 (m, 7H), 7,14 (m, 2H), 6,85 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 5,17 (s ancho, 2H), 4,29 (s ancho, 2H), 4,05 (m, 2H).
156	δ 8,22 (d, 1H), 7,30 (d, 2H), 6,97 (d, 1H), 6,73 (d, 2H), 4,22 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 3,00 (s, 6H), 2,10 (m, 2H), 1,94 (m, 2H).
160	δ 8,48 (d, 1H), 7,37 (d, 2H), 7,12 (d, 1H), 6,96 (d, 2H), 4,23 (m, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 3,25 (m, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,96 (m, 2H).
161	δ 8,53 (d, 1H), 7,40 (s, 4H), 7,09 (d, 1H), 4,24 (m, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,25 (m, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
162	δ 8,50 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,07 (m, 2H), 4,24 (m, 2H), 3,32 (s, 3H), 3,26 (m, 2H), 2,30 (m, 3H), 2,12 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
163	δ 8,52 (d, 1H), 7,47 (m, 2H), 7,18 (m, 2H), 7,11 (d, 1H), 5,27 (s, 2H), 4,29 (m, 2H), 4,19 (m, 2H), 3,34 (s, 3H).
164	δ 8,55 (d, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 7,27 (m, 1H), 7,14 (m, 1H), 7,06 (d, 1H), 4,27 (m, 2H), 3,29 (m, 2H), 3,23 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,99 (m, 2H).
165	δ 8,20 (d, 1H), 7,95 (m, 2H), 7,68(d, 1H), 7,52 (m, 3H), 7,38 (m, 1H), 6,59 (d, 1H), 4,31 (m, 2H), 3,42 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,18 (m, 2H), 2,05 (m, 2H).
166	δ 8,42 (d, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,62 (m, 2H), 7,40 (m, 1H), 6,67 (d, 1H), 4,26 (m, 2H), 3,34 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 2,02 (m, 2H).
168	δ 8,55(d, 1H), 7,47 (m, 1H), 7,42(m, 1H), 7,21 (d, 1H), 7,14 (m, 1H), 4,23 (m, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,25 (m, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,96 (m, 2H).
169	δ 8,40 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,29 (m, 3H), 6,79 (d, 1H), 4,25 (m, 2H), 3,36 (m, 2H), 3,28 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 2,12 (m, 3H), 2,01 (m, 2H).
170	δ 8,56 (d, 1H), 7,69 (d, 2H), 7,60 (d, 2H), 7,08 (d, 1H), 4,26 (t, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,25 (t, 2H), 2,14 (m, 2H), 1,98 (m, 2H).
171	δ 8,55 (d, 1H), 7,63 (s ancho, 1H), 7,19 (s ancho, 1H), 7,12 (d, 1H), 4,25 (t, 2H), 3,54 (s, 3H), 3,31 (m, 5H), 2,14 (m, 2H), 2,00 (m, 2H).
172	δ 8,53 (d, 1H), 7,39 (m, 1H), 7,21 (m, 2H), 7,12 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,25 (t, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,98 (m, 2H).
173	δ 8,60 (d, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,01 (m, 2H), 6,87 (m, 1H), 4,24 (t, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,24 (t, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
174	δ 8,53 (d, 1H), 7,44 (m, 2H), 7,13 (t, 2H), 7,08 (d, 1H), 4,24 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,25 (t, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
175	δ 8,55 (d, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,35 (m, 3H), 7,11 (d, 1H), 4,25 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,25 (t, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,99 (m, 2H).
176	δ 8,58 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,09 (d, 1H), 4,24 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,23 (t, 2H), 2,11 (m, 2H), 1,95 (m, 2H).
177	δ 8,48 (d, 1H), 7,24 (m, 4H), 7,11 (d, 1H), 4,25 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,26 (t, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 1,97 (m, 2H).
178	δ 8,53 (d, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,16(t, 2H), 7,10 (d, 1H), 5,61 (t, 2H), 4,17 (m, 2H), 3,46 (m, 2H), 3,33 (s, 3H).

(continuación)

Comp. n°	Datos de RMN de ^1H (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
179	δ 8,00 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,34 (m, 3H), 6,24 (d, 1H), 5,08 (s, 1H), 4,23 (t, 2H), 3,35 (m, 2H), 3,14 (t, 2H), 2,10 (m, 2H), 2,91 (m, 2H), 1,62 (m, 2H), 0,97 (t, 3H).
182	δ 8,16 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,34 (m, 4H), 6,96 (m, 3H), 6,46 (d, 1H), 4,24 (t, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,07 (t, 2H), 2,11 (m, 2H), 2,90 (m, 2H).
187	δ 8,02 (d, 1H) 7,36 (s, 1H) 7,24 (m, 2 H) 7,15 (d, 1H) 6,27 (d, 1 H) 5,17 (m, 1H) 4,22 (t, 2H) 3,16 (t, 2H) 2,99 (d, 3H) 2,35 (s, 3H) 2,09 (m, 2H) 1,91 (m, 2H).
Los espectros de ^1H RMN se informan en ppm de campo bajo el de tetrametilsilano; Los acoplamientos se designan por (s)-singlete, (d)-doblete, (t)-triplete, (m)-multiplete, (dd)-doblete de dobletes, (s ancho)-singlete ancho.	

Ejemplos biológicos de la invención

Protocolo general para preparar suspensiones de ensayo para los Ensayos A-M: Los compuestos de ensayo se disolvieron en primer lugar en acetona en una cantidad igual a 3% del volumen final y a continuación se suspendieron a la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (mezcla 50/50) que contenía 250 ppm del tensioactivo Trem[®] 014 (ésteres de alcoholes polihidroxilados). Las suspensiones de ensayo resultantes se usaron a continuación en los Ensayos A-M. Pulverizar una suspensión de ensayo 200 ppm hasta el punto de escurrimiento sobre las plantas de ensayo fue el equivalente a una dosis de aplicación de 500 g/ha.

Ensayo A

- 10 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de trigo. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con un polvo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (el agente causal del mildiu pulverulento del trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento a 20°C durante 8 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo B

- 15 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de trigo. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (el agente causal de la roya de la hoja del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 7 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

20 Ensayo C

- La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de trigo. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Fusarium graminearum* (el agente causal de la sarna de las espigas del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 72 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 5 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo D

- La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de trigo. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Septoria nodorum* (el agente causal de las manchas del cascabello del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 48 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 7 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo E

- La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de trigo. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Septoria tritici* (el agente causal de las manchas foliares del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 48 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 19 días más, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo F

- La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de pepino. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Colletotrichum orbiculare* (el agente causal de la antracnosis por *Colletotrichum* del pepino) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h, y

luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 5 días más, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo G

- 5 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de trigo. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Alternaria solani* (el agente causal del tizón temprano del tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 27°C durante 48 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 5 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo H

- 10 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de tomate. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea* (el agente causal de la botritis del tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 48 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 24°C durante 3 días más, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo I

- 15 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de agrotis rastrera. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Rhizoctonia oryzae* (el agente causal de las manchas pardas del césped) y se incubaron en una atmósfera saturada a 27°C durante 48 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 27°C durante 3 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo J

- 20 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de tomate. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (el agente causal del tizón tardío del tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 4 días, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo K

- 30 Se inoculaban plántulas de vid con una suspensión de esporas de *Plasmopara viticola* (el agente causal de mildiu lanuginoso de la vid) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h. Después de un corto período de secado, se pulverizó la suspensión de ensayo hasta el punto de escurrimiento sobre las plántulas de vid y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 6 días, tiempo después del cual se colocaron las unidades de ensayo de nuevo en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h. Después de retirarlas, se realizaron las evaluaciones de la enfermedad.

Ensayo L

- 35 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de poas. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Pythium aphanidermatum* (el agente causal del tizón por *Pythium* de las poas) y se incubaron en contenedores cubiertos para proporcionar una atmósfera saturada a 27°C durante 48 h, y luego se retiraron las cubiertas y se dejaron las plantas a 27°C durante 3 días más, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.

Ensayo M

- 40 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre de plántulas de pepino. Al día siguiente, las plántulas se inoculaban con una suspensión de esporas de *Sclerotinia sclerotiorum* (el agente causal del moho blanco del pepino) y se incubaron en una atmósfera saturada a 24°C durante 72 h, y luego se trasladaron a una cámara de crecimiento a 24°C durante 3 días más, tiempo después del cual se realizaron las evaluaciones de enfermedad.
- 45 Los resultados de los Ensayos A-M se presentan en la Tabla A. En la tabla, una puntuación de 100 indica un control de la enfermedad de 100 % y una puntuación de 0 indica que no se controla la enfermedad (con respecto a los controles). Un raya (-) indica que no hay resultados del ensayo. Todos los resultados son para una suspensión de ensayo de 200 ppm salvo cuando van seguidos por "*" que indica 40 ppm o por "***" que indica 10 ppm.

ES 2 398 677 T3

Tabla A

Comp. nº	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J	Ensayo K	Ensayo L	Ensayo M
1	94	100	100	98	98	96	-	91	41	100	0	100	99
2	0	98	-	98	97	85	-	92	31	47	0	100	0
3	47	91	99	0	72	0	-	0	0	0	0	0	-
4	0	92	100	60	90	8	-	55	0	0	21	0	-
5	96	100	100	97	97	99	98*	99	0	99	-	100	-
6	0	73	100	0	-	0	-	0	0	0	0	0	-
7	82	99	100	98	99	90	-	82	0	93	0	0	-
8	81	99	100	100	100	99	99*	97	62	100	-	100	-
9	52	97	99	92	0	79	-	81	0	0	0	0	-
10	90	99	99	87	-	0	-	63	0	64	0	42	-
11	93	99	100	99	98	83	-	97	44	100	0	100	-
12	97	99	100	99	100	94	-	98	64	100	0	100	-
13	98	99	100	97	-	31	-	29	77	97	0	100	-
14	95	91	100	73	99	0	-	0	0	60	0	0	-
15	86	99	100	98	-	17	-	92	0	97	0	100	-
16	20	99	99	0	-	0	-	19	0	91	0	70	-
17	64	99	100	98	-	77	-	97	0	100	86	100	-
18	96	100	100	97	-	98	-	74	0	99	0	100	-
19	26	99	100	98	-	66	-	74	0	31	0	93	-
20	78	99	100	99	-	88	-	96	0	99	0	100	-
21	96	-	-	82	100	-	-	-	-	52	-	76	-
22	50	-	-	87	94	-	-	-	-	83	-	77	-
23	99	-	-	94	98	-	-	-	-	71	-	0	-
24	97	-	-	98	98	-	-	-	-	72	-	0	-
25	96	-	-	87	97	-	-	-	-	83	-	100	-
26	91	-	-	99	96	-	-	-	-	91	-	100	-
27	96	95*	99*	98	97	66**	95**	-	-	97	-	98	-
28	94	-	-	92	96	-	-	-	-	95	-	98	-
29	0	95	100	98	85	-	-	-	-	47	-	0	-
30	0	91	92	69	93	-	-	-	-	47	-	0	-
31	0	95	94	78	98	-	-	-	-	80	-	99	-
32	0*	74*	0*	0*	-	-	-	-	-	98*	-	99*	-
33	0*	77*	98*	94*	-	-	-	-	-	95*	-	97*	-
34	96	100	98	100	94	-	-	-	-	91	-	100	-
35	0	99	99	99	100	-	-	-	-	67	-	0	-
36	0	91	99	96	96	-	-	-	-	90	-	99	-

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J	Ensayo K	Ensayo L	Ensayo M
37	70	86	96	0	68	-	-	-	-	95	-	93	-
38	0	94	96	64	92	-	-	-	-	95	-	99	-
39	0	67	60	60	88	-	-	-	-	0	-	0	-
40	0	85	84	99	98	-	-	-	-	0	-	0	-
41	0	79	0	0	50	-	-	-	-	0	-	91	-
42	0	85	66	0	59	-	-	-	-	99	-	100	-
43	0	92	98	90	96	-	-	-	-	97	-	100	-
44	91	85	99	89	100	-	-	-	-	65	-	0	-
45	41	89	0	60	97	-	-	-	-	76	-	85	-
46	0	74	0	0	50	-	-	-	-	97	-	100	-
47	0	91	69	0	94	-	-	-	-	99	-	100	-
48	0	99	99	0	99	-	-	-	-	99	-	100	-
49	76	99	100	100	90	-	-	-	-	100	-	99	-
50	0*	0*	92*	0*	-	-	-	-	-	31*	-	68*	-
51	81	98	100	100	100	-	-	-	-	93	-	100	-
52	0	100	99	97	98	-	-	-	-	95	-	100	-
53	0*	98*	99*	84*	-	-	-	-	-	99*	-	100*	-
54	0*	98*	95*	60*	-	-	-	-	-	99*	-	100*	-
55	0*	91*	99*	44*	-	-	-	-	-	17*	-	0*	-
56	86*	0*	100*	99*	-	-	-	-	-	93*	-	100*	-
57	0*	86*	0*	0*	-	-	-	-	-	99*	-	100*	-
58	0*	0*	100*	82*	-	-	-	-	-	26*	-	62*	-
59	0*	92*	99*	94*	-	-	-	-	-	71*	-	67**	-
60	0	74	91	64	71	-	-	-	-	9	-	0	-
61	79	94	98	99	98	-	-	-	-	97	-	99	-
62	78*	80*	98*	60*	-	-	-	-	-	96*	-	99*	-
63	81	91	0	0	82	-	-	-	-	9	-	100	-
64	0	0	0	0	0	-	-	-	-	0	-	0	-
65	28	65	87	31	98	-	-	-	-	43	-	99	-
66	0	88	83	0	72	-	-	-	-	97	-	100	-
67	0	100	100	78	93	-	-	-	-	99	-	100	-
68	0	98	99	95	93	-	-	-	-	95	-	100	-
69	59	97	100	99	100	-	-	-	-	97	-	100	-
70	83	0*	0*	90	84*	91	46*	29	9	53*	-	98*	-
71	0	0*	0*	64	33*	0	0*	0	-	9*	-	97*	-
72	0	94*	0*	82	47*	0	98*	77	0	99*	-	100*	-
73	0	85*	0*	78	84*	0	0*	0	0	17*	-	98*	-

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J	Ensayo K	Ensayo L	Ensayo M
74	20	91*	10*	60	86*	0	0*	0	0	0*	-	93*	-
75	31	0*	0*	0	92*	0	0*	0	0	0*	-	0*	-
77	82	-	92*	49	0*	0	0*	29	0	40*	-	0*	-
78	58	-	99*	69	60*	0	0*	0	0	17*	-	0*	-
79	76	-	99*	69	93*	0	0*	0	0	0*	-	0*	-
80	82	-	98*	82	93*	0	68*	44	0	33*	-	0*	-
81	0	98	98	87	100	-	-	-	-	99	-	95	-
82	81	91	96	60	97	-	-	-	-	99	-	0	-
83	0	0	0	60	67	-	-	-	-	93	-	99	-
84	60	99	100	99	-	98	-	52	16	93	0	100	-
85	0	99	100	82	-	88	-	52	16	67	0	100	-
86	0	-	0	51	-	0	-	0	0	94	0	99	-
87	0	-	99	78	-	0	-	0	0	94	0	99	-
88	0	-	100	60	-	0	-	21	0	100	0	99	-
89	21	-	100	60	-	0	-	8	0	0	0	99	-
90	96	99	100	100	-	17	-	0	0	99	0	97	-
91	74	99	100	98	-	16	-	99	0	0	0	88	-
92	94	99	100	99	-	80	-	90	0	99	0	99	-
93	0	0	99	0	-	0	-	0	0	95	0	90	-
94	82	97	100	98	-	24	-	96	16	99	0	99	-
95	68	100	100	99	-	21	-	87	0	99	0	95	-
96	0	19	96	0	62	-	-	-	-	98	-	83	-
97	0	55	100	82	61	-	-	-	-	96	-	100	-
98	0	74	97	82	95	-	-	-	-	88	-	99	-
99	0	94	99	89	98	-	-	-	-	99	-	100	-
100	0	89	99	90	92	-	-	-	-	98	-	100	-
101	0	89	99	92	94	-	-	-	-	57	-	91	-
102	73	92	100	97	100	-	-	-	-	96	-	99	-
103	85	95	99	99	100	-	-	-	-	99	-	100	-
104	0	0	55	0	88	-	-	-	-	88	-	91	-
105	0	94	94	78	100	-	-	-	-	73	-	0	-
106	0	94	92	69	72	-	-	-	-	9	-	0	-
107	92	99	99	99	100	99	99*	90	80	100	-	100	-
108	43	99	98	87	99	-	-	-	-	77	-	100	-
109	92	-	100	0	100	-	-	-	-	99	-	100	-
110	0	95	92	60	17	-	-	-	-	99	-	100	-
111	21	95	95	64	31	-	-	-	-	80	-	100	-

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J	Ensayo K	Ensayo L	Ensayo M
112	0	95	100	93	99	-	-	-	-	99	-	99	-
113	0	97	99	78	91	-	-	-	-	96	-	100	-
114	57	100	94	73	86	-	-	-	-	100	-	100	-
115	0*	63*	0*	69*	-	-	-	-	-	73*	-	-	-
116	90	93	100	92	91	-	-	-	-	95	-	100	-
117	86	97	99	98	98	-	-	-	-	95	-	100	-
118	0	86	98	78	82	-	-	-	-	80	-	99	-
119	61	76	100	99	87	-	-	-	-	93	-	92	-
120	86	90	100	100	95	-	-	-	-	88	-	98	-
121	0	94	99	84	93	15	89	66	-	97	-	99	-
122	0	96	99	73	80	-	-	-	-	99	-	100	-
123	0	90	99	0	31	-	-	-	-	91	-	100	-
124	0	86	98	60	54	-	-	-	-	66	-	99	-
125	20	86	100	89	88	-	-	-	-	100	-	100	-
126	0	86	99	82	70	-	-	-	-	87	-	99	-
127	0	97	96	60	86	-	-	-	-	100	-	99	-
128	0	96*	99*	99	94*	99	99*	89	-	100*	-	100*	-
129	0	98*	100*	99	81*	-	95*	84	53	95*	-	100*	-
130	86	92*	0*	97	97*	0	58*	34	0	100*	-	100*	-
131	96	100	100	87	-	58	81	9	57	97	0	100	-
132	66	88*	0*	0	0*	0	0*	0	0	65*	-	100*	-
133	0	19*	42*	0	0*	98	0*	0	0	73*	-	99*	-
134	91	85*	84*	96	77**	99*	98**	53	24	90**	-	100*	-
135	95	61*	84*	89	90*	99	99*	70	0	70*	-	-	-
136	0	92*	77*	97	28*	0	99*	41	0	57*	-	100*	-
137	86	0*	69*	92	73*	0	99*	0	0	53*	-	99*	-
138	0	98*	86*	99	83*	-	99*	68	0	88*	-	99*	-
139	73	90*	95*	99	29*	-	99*	0	40	93*	-	100*	-
140	0	90	98	0	49	-	-	-	-	26	-	99	-
142	95	100	97	98	100	-	0	53	-	-	-	-	-
143	96	100	99	100	100	-	-	-	86	-	-	-	-
179	75	100	100	99	100	-	-	-	89	-	-	-	-
180	79	99	96	98	100	-	-	96	-	-	-	-	-
181	97	100	100	100	100	-	99	94	-	-	-	-	-
182	92	77	-	97	100	-	-	81	-	-	-	-	-
183	-	100	99	97	100	-	-	81	-	-	-	-	-
184	61	99	99	90	100	-	98	80	-	-	-	-	-

ES 2 398 677 T3

(continuación)

Comp. nº	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J	Ensayo K	Ensayo L	Ensayo M
185	74	97	-	99	97	-	95	99	-	-	-	-	-
186	79	99	-	99	95	-	99	99	-	-	-	-	-
187	79	99	-	92	99	-	-	92	-	-	-	-	-

opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , ciano, nitro, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinito C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfinito C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ; alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcocarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 o trialquilsililo C_3-C_6 ;

R^8 es alquilo C_1-C_3 ;

R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$, $NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$, $-OR^{12}$, $-N=CR^{13a}R^{13b}$ o $-NR^{10}N=CR^{14a}R^{14b}$;

cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinitalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcocarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxicarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxicarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxicarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxi(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquil(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , dialquilamino(tiocarbonilo) C_3-C_{10} , alquilsulfonilaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonilaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoci(alquil)aminocarbonilo C_3-C_{10} , alcoci C_1-C_{10} , haloalcoxi C_1-C_{10} , cicloalcoxi C_3-C_{10} , alquilsulfonilo C_1-C_{10} , haloalquilsulfonilo C_1-C_{10} , cicloalquilsulfonilo C_3-C_{10} , alquilaminosulfonilo C_1-C_{10} , dialquilaminosulfonilo C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

cada R^{9b} y R^{11b} independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinitalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcocarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxicarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxicarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxicarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxi(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquil(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , dialquilamino(tiocarbonilo) C_3-C_{10} , alquilsulfonilaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonilaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoci(alquil)aminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilsulfonilo C_1-C_{10} , haloalquilsulfonilo C_1-C_{10} , cicloalquilsulfonilo C_3-C_{10} , alquilaminosulfonilo C_1-C_{10} , dialquilaminosulfonilo C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$; o

cada pareja de R^{9a} y R^{9b} , o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de carbono y heteroátomos, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, $-CN$, alquilo C_1-C_2 y alcoxi C_1-C_2 ;

R^{12} es H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_2-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinitalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcocarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxicarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxicarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxicarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxi(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquil(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(tiocarbonilo) C_2-C_{10} , dialquilamino(tiocarbonilo) C_3-C_{10} , alquilsulfonilaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonilaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoci(alquil)aminocarbonilo C_3-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxi C_1-C_5 ; o

una pareja geminal de R^{15a} y R^{15b} se toma junto con el átomo de carbono al que está unida formando $-C(=O)-$ o un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ; o

R^{15a} y R^{15b} unidos a átomos de carbono adyacentes se toman junto con los átomos de carbono a los que están unidos formando un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ;

cada R^{16} es independientemente fenilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno; con la condición de que cuando R^{12} es $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$ y m es 0, entonces R^{16} es distinto de cicloalcoxi C_3-C_8 o cicloalquenilo C_3-C_8 ;

cada R^{17} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , ciano, nitro, alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , halocicloalcoxi C_3-C_8 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_6 , fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;

cada m es independientemente 0, 1 o 2;

cada R^{10} es independientemente H, alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_5 , haloalquenilo C_2-C_5 , haloalquinilo C_2-C_5 , alcoxialquilo C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 o alcoxi C_1-C_5 ;

cada R^{13a} y R^{13b} es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilaminoalquilo C_2-C_6 , haloalquilaminoalquilo C_2-C_6 , cicloalquilaminoalquilo C_4-C_6 , dialquilaminoalquilo C_3-C_6 , halodialquilaminoalquilo C_3-C_6 , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_5-C_{10} , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_{10} , alquiltio C_1-C_{10} , haloalquiltio C_1-C_{10} , cicloalquiltio C_3-C_{10} , trialquilsililo C_3-C_{10} o halotrialquilsililo C_3-C_{10} ; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_3 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_3 ; o

R^{13a} y R^{13b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ o $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y opcionalmente sustituidos en miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_2 ;

cada R^{14a} y R^{14b} es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilaminoalquilo C_2-C_6 , haloalquilaminoalquilo C_2-C_6 , cicloalquilaminoalquilo C_4-C_6 , dialquilaminoalquilo C_3-C_6 , halodialquilaminoalquilo C_3-C_6 , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_5-C_{10} , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_{10} , alquiltio C_1-C_{10} , haloalquiltio C_1-C_{10} , cicloalquiltio C_3-C_{10} , trialquilsililo C_3-C_{10} o halotrialquilsililo C_3-C_{10} ; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ o $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_3 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_3 ; o

R^{14a} y R^{14b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ o $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 , halógeno, $-CN$ y alcoxi C_1-C_2 ;

p y q son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de $S(=O)_p(=NR^4)_q$, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2; y

cada R^{18} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 o alquilcicloalquilo C_4-C_7 .

2. Un compuesto de la reivindicación 1 en el que

Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $C(=O)$, $C(=S)$, y $S(=O)_p(=NR^4)_q$;

5 cada R^2 es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, $-CHO$, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 ;

R^3 es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHCN$, $-CHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, alquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , haloalquilcarbonilo C_2-C_4 , alcóxicarbonilo C_2-C_4 o haloalcóxicarbonilo C_2-C_4 ;

10 J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos naftalenilo, o un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$ o $C(=S)$, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 ;

R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$, $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$ o $-OR^{12}$;

15 cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alcóxialquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

20 R^{12} es H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H, halógeno o alquilo C_1-C_5 ;

25 cada R^{16} es independientemente fenilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

m es 0 o 1;

30 cada R^{17} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o ciano; o fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; y

R^{10} es H, alquilo C_1-C_5 o haloalquilo C_1-C_5 .

3. Un compuesto de la reivindicación 2 en el que

35 Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos (que están identificados con "1" y "5" respectivamente) formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S y NR^3 ;

R^3 es independientemente H, $-C(=O)NH_2$, $-CHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, alquilcarbonilo C_2-C_3 o alcóxicarbonilo C_2-C_3 ;

40 J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

cada R^7 es independientemente halógeno o alquilo C_1-C_3 ;

R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$ o $-NR^{10}-NR^{11a}R^{11b}$;

45 cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente alquilo C_1-C_6 , alcóxialquilo C_2-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

m es 0;

cada R^{16} es independientemente cicloalquilo C_3-C_8 o fenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} ;

R^{17} es halógeno, alquilo C_1-C_6 o ciano; y

R^{10} es H o metilo.

5 4. Un compuesto de la reivindicación 3 en el que

R^2 es H;

J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ;

cada R^7 es independientemente F o CH_3 ;

10 R^1 es $-NR^{9a}R^{9b}$;

R^{9a} es independientemente isopropilo o ciclopropilo; y

R^{9b} es independientemente H.

5. Un compuesto de la reivindicación 4 en el que

15 Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$ y O; y

J es un anillo fenilo o tiofeno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de F y CH_3 .

6. El compuesto de la reivindicación 1 que se selecciona del grupo:

4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-N-(1-metiletil)-2-pirimidinamina,

20 N-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-2-pirimidinamina,

4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-N-(1-metiletil)-2-pirimidinamina,

2-[[4-[2-(4-fluorofenil)-6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-2-pirimidinil]amino]-1-propanol,

2-[[4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[5,1-a]piridin-3-il]-2-pirimidinil]amino]-1-propanol,

N-ciclopropil-4-[2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-il]-2-pirimidinamina,

25 N-(1-metiletil)-4-(4,5,6,7-tetrahidro-2-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-2-pirimidinamina,

N-ciclopropil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-2-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-2-pirimidinamina,

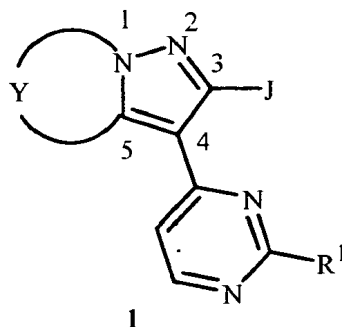
(2S)-2-[[4-(4,5,6,7-tetrahidro-2-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-2-pirimidinil]amino]-1-propanol,

4-(6,7-dihidro-2-fenil-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il)-N-(1-metiletil)-2-pirimidinamina,

N-ciclopropil-4-(6,7-dihidro-2-fenil-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il)-2-pirimidinamina,

30 N-ciclopropil-4-[6,7-dihidro-2-(3-tienil)-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-il]-2-pirimidinamina,

7. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de Fórmula 1, N-óxidos y sales del mismo,



en la que

Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $-C(R^2)=N-$, $-N=N-$, $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y $SiR^{5a}R^{5b}$;

5 cada R^2 es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, $-CHO$, $-NHCHO$, $-N_3$, $-N=C=O$, $-N=C=S$, $-SH$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHCN$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 , haloalcoxi C_1-C_5 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_5 , haloalquenilo C_3-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 , haloalquilcarbonilo C_2-C_5 , alcoxycarbonilalcoxi C_3-C_5 , alquiltio C_1-C_5 , haloalquiltio C_1-C_5 , cicloalquiltio C_3-C_6 , alquil(tiocarbonilo) C_2-C_5 , alquiltio(tiocarbonilo) C_2-C_5 , alquilsulfino C_1-C_5 , haloalquilsulfino C_1-C_5 , cicloalquilsulfino C_3-C_6 , alquilsulfono C_1-C_5 , haloalquilsulfono C_1-C_5 , cicloalquilsulfono C_3-C_6 , alquilsililo C_3-C_5 , haloalquilsililo C_3-C_5 , alquilamino C_1-C_5 , haloalquilamino C_2-C_5 , cicloalquilamino C_3-C_6 , dialquilamino C_2-C_5 o haloalquilamino C_3-C_5 ; o

15 dos R^2 unidos a átomos de carbono de anillo adyacentes se toman juntos formando un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado de 5 a 7 miembros, opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

20 cada R^3 es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHCN$, $-CHO$, $-NHCHO$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, hidroxilo, alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_7 , haloalquilo C_1-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 , haloalquilcarbonilo C_2-C_5 , cicloalquilcarbonilo C_4-C_7 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , haloalcoxycarbonilo C_2-C_6 , cicloalcoxycarbonilo C_4-C_7 , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_6 , alcoxialcoxycarbonilo C_3-C_6 , (alquiltio)carbonilo C_2-C_6 , alcoxi(tiocarbonilo) C_2-C_6 , alquil(tiocarbonilo) C_2-C_6 , alquiltio(tiocarbonilo) C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_7 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 , alquilamino(tiocarbonilo) C_2-C_6 , dialquilamino(tiocarbonilo) C_3-C_6 , alcoxi(alquil)aminocarbonilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_5 , haloalcoxi C_1-C_5 , alquiltio C_1-C_5 , haloalquiltio C_1-C_5 , cicloalquiltio C_3-C_6 , alquilaminosulfono C_1-C_5 , alquilsililo C_3-C_5 o haloalquilsililo C_3-C_5 ;

cada R^4 es independientemente H, ciano, amino, hidroxilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_6 , haloalquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , fenilo o benzilo;

30 cada R^{5a} y R^{5b} es independientemente alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_5 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_7 , haloalquilo C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 o haloalcoxi C_1-C_5 ;

cada R^6 es independientemente H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 o bencilo;

35 cada R^{6a} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 o alquilocicloalquilo C_4-C_7 ;

J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno; o

J es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

45 cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , ciano, nitro, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfono C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfino C_1-C_6 , haloalquilsulfono C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 o alquilsililo C_3-C_6 ;

50 R^8 es alquilo C_1-C_3 ;

R^1 es H, $-NR^{9a}R^{9b}$, $-NR^{10}$, $-NR^{11a}R^{11b}$, $-OR^{12}$, $-N=CR^{13a}R^{13b}$ o $-NR^{10}N=CR^{14a}R^{14b}$;

cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-

5 C₁₀, haloalcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfinilalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcoxycarbonilo C₂-C₁₀, haloalcoxycarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcoxycarbonilo C₄-C₁₀, alcoxialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcoxialcoxycarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcoxí(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfinilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfinilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcoxí(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀, alcoxí C₁-C₁₀, haloalcoxí C₁-C₁₀, cicloalcoxí C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₀, cicloalquilsulfonilo C₃-C₁₀, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₀, dialquilaminosulfonilo C₂-C₁₀ o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

10 cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₂-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-C₁₀, alcoxialquenilo C₃-C₁₀, alcoxialquinilo C₃-C₁₀, dialcoxialquilo C₃-C₁₀, trialcoxialquilo C₄-C₁₀, haloalcoxialquilo C₂-C₁₀, alcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, haloalcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfinilalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcoxycarbonilo C₂-C₁₀, haloalcoxycarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcoxycarbonilo C₄-C₁₀, alcoxialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcoxialcoxycarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcoxí(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfinilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfinilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcoxí(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₀, cicloalquilsulfonilo C₃-C₁₀, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₀, dialquilaminosulfonilo C₂-C₁₀ o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$; o

15 cada pareja de R^{9a} y R^{9b}, o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de carbono y heteroátomos, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo

20 carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, -CN, alquilo C₁-C₂ y alcoxí C₁-C₂;

25 R¹² es H, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₂-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-C₁₀, alcoxialquenilo C₃-C₁₀, alcoxialquinilo C₃-C₁₀, dialcoxialquilo C₃-C₁₀, trialcoxialquilo C₄-C₁₀, haloalcoxialquilo C₂-C₁₀, alcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, haloalcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₂-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfinilalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcoxycarbonilo C₂-C₁₀, haloalcoxycarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcoxycarbonilo C₄-C₁₀, alcoxialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcoxialcoxycarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcoxí(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfinilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfinilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcoxí(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀ o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;

30 cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₅ o alcoxí C₁-C₅; o

35 una pareja geminal de R^{15a} y R^{15b} se toma junto con el átomo de carbono al que está unida formando -C(=O)- o un anillo cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o

R^{15a} y R^{15b} unidos a átomos de carbono adyacentes se toman junto con los átomos de carbono a los que están unidos formando un anillo cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆;

40 cada R¹⁶ es independientemente fenilo, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalcoxí C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo

45 átomo de nitrógeno; con la condición de que cuando R¹² es $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$ y m es 0, entonces R¹⁶ es distinto de cicloalcoxí C₃-C₈ o cicloalquenilo C₃-C₈;

50 cada R¹⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, ciano, nitro, alcoxí C₁-C₆, cicloalcoxí C₃-C₈, halocicloalcoxí C₃-C₈, haloalcoxí C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-

C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alcocarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, trialquilsililo C₃-C₆, fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;

cada m es independientemente 0, 1 o 2;

5 cada R¹⁰ es independientemente H, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₅, haloalquenilo C₂-C₅, haloalquinilo C₂-C₅, alcocalquilo C₂-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅ o alcoxi C₁-C₅;

10 cada R^{13a} y R^{13b} es independientemente H, -CN, -C(=O)OR¹⁸, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilaminoalquilo C₂-C₆, haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₆, halodialquilaminoalquilo C₃-C₆, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₅-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, cicloalquiltio C₃-C₁₀, trialquilsililo C₃-C₁₀ o halotrialquilsililo C₃-C₁₀; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₃, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₃; o

20 R^{13a} y R^{13b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q y opcionalmente sustituidos en miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₂;

25 cada R^{14a} y R^{14b} es independientemente H, -CN, -C(=O)OR¹⁸, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilaminoalquilo C₂-C₆, haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₆, halodialquilaminoalquilo C₃-C₆, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₅-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, cicloalquiltio C₃-C₁₀, trialquilsililo C₃-C₁₀ o halotrialquilsililo C₃-C₁₀; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₃, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₃; o

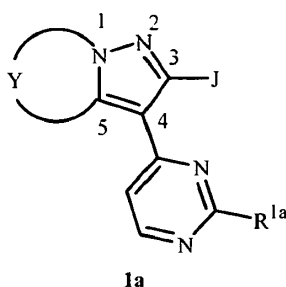
35 R^{14a} y R^{14b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₂;

p y q son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de S(=O)_p(=NR⁴)_q, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2; y

40 cada R¹⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o alquilcicloalquilo C₄-C₇,

que comprende:

poner en contacto un compuesto de Fórmula 1a



45 con un compuesto de Fórmula 2

R^{1H} 2

o un agente reductor:

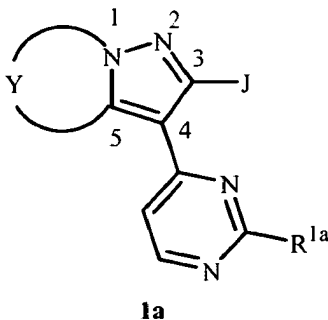
en la que

R^{1a} es halógeno, -SCH₃, -S(=O)CH₃, -S(=O)₂CH₃, -OS(=O)₂CH₃, -OS(=O)₂CF₃ o -OS(=O)₂Ph-*p*-CH₃; y

(a) cuando R^1 es distinto de hidrógeno, entonces el compuesto de Fórmula **1a** se pone en contacto con el compuesto de Fórmula **2** en presencia de una base; y

(b) cuando R¹ es hidrógeno, entonces R^{1a} es halógeno y el compuesto de Fórmula **1a** se pone en contacto con el agente reductor.

8. Un compuesto seleccionado de la Fórmula **1a**, N-óxidos y sales del mismo,



en la que

R^{1a} es halógeno, -SCH₃, -S(=O)CH₃, -S(=O)₂CH₃, -OS(=O)₂CH₃, -OS(=O)₂CF₃ o -OS(=O)₂Ph-*p*-CH₃;

Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $-C(R^2)=N-$, $-N=N-$, $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y $SiR^{5a}R^{5b}$;

cada R² es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, -CHO, -NHCHO, -N₃, -N=C=O, -N=C=S, -SH, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, cicloalcoxi C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₅, haloalqueniloxi C₃-C₅, alquiniloxi C₂-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, alquilcarboniloxi C₂-C₅, haloalquilcarboniloxi C₂-C₅, alcoxycarbonilalcoxi C₃-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquilsulfínilo C₁-C₅, haloalquilsulfínilo C₁-C₅, cicloalquilsulfínilo C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₅, haloalquilsulfonilo C₁-C₅, cicloalquilsulfonilo C₃-C₆, trialkilsililo C₃-C₅, haloalkilsililo C₃-C₅, alquilamino C₁-C₅, haloalquilamino C₂-C₅, cicloalquilamino C₃-C₆, dialquilamino C₂-C₅ o halodialquilamino C₃-C₅; o

dos R² unidos a átomos de carbono de anillo adyacentes se toman juntos formando un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado de 5 a 7 miembros, opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

cada R³ es independentemente H, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -CHO, -NHCHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, hidroxi, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquínilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, haloalquilcarbonilo C₂-C₅, cicloalquilcarbonilo C₄-C₇, alcocicarbonilo C₂-C₆, haloalcocicarbonilo C₂-C₆, cicloalcocicarbonilo C₄-C₇, alcocialquilcarbonilo C₃-C₆, alcocialcocicarbonilo C₃-C₆, (alquiltio)carbonilo C₂-C₆, alcoxi(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₇, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₆, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₆, alcoxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilaminosulfonilo C₁-C₅, trialquilsililo C₃-C₅ o halotrialquilsililo C₃-C₅;

cada R⁴ es independientemente H, ciano, amino, hidroxí, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o benzoilo;

cada R^{5a} y R^{5b} es independientemente alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₅, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquicicloalquilo C₄-C₇, alquicicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅ o haloalcoxi C₁-C₅;

cada R^6 es independientemente H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 o bencilo;

cada R^{6a} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 o alquilocicloalquilo C_4-C_7 ;

5 J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno; o

10 J es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

15 cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , ciano, nitro, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfino C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_1-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 o trialkilsililo C_3-C_6 ; R^8 es alquilo C_1-C_3 ; y

p y q son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de $S(=O)_p(=NR^3)_q$, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2.

20 9. Un compuesto de la reivindicación 8 en el que

R^{1a} es halógeno o $-S(=O)_2CH_3$.

10. Un compuesto de la reivindicación 9 en el que

R^{1a} es Cl o $-S(=O)_2CH_3$.

11. El compuesto de la reivindicación 8 que se selecciona del grupo:

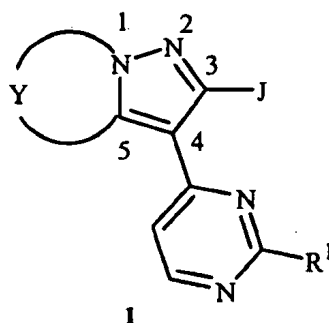
25 2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]pirazolo[1,5-a]piridina,

3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina,

3-(2-cloro-4-pirimidinil)-2-(4-fluorofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-b]piridazina, y

2-(4-fluorofenil)-4,5-dihidro-3-[2-(metilsulfonil)-4-pirimidinil]-7H-pirazolo[1,5-c][1,3]oxazina.

12. Una composición fungicida que comprende (a) un compuesto de Fórmula 1, N-óxidos y sales del mismo,



30

en la que

Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en $C(R^2)_2$, O, S, NR^3 , $-C(R^2)=C(R^2)-$, $-C(R^2)=N-$, $-N=N-$, $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $S(=O)_p(=NR^4)_q$ y $SiR^{5a}R^{5b}$;

35

cada R^2 es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, $-CHO$, $-NHCHO$, $-N_3$, $-N=C=O$, $-N=C=S$, $-SH$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHCN$, $-C(=O)OR^6$, $-C(=O)NHOR^{6a}$, alquilo C_1-C_5 , alqueno C_2-C_5 , alquino C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalqueno C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 , haloalcoxi C_1-C_5 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquenoiloxi C_2-C_5 , haloalquenoiloxi C_3-C_5 , alquinoiloxi C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 ,

alquilcarboniloxi C₂-C₅, haloalquilcarboniloxi C₂-C₅, alcoxicarbonilalcoxi C₃-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquilsulfonilo C₁-C₅, haloalquilsulfonilo C₁-C₅, cicloalquilsulfonilo C₃-C₆, trialquilsililo C₃-C₅, halotrialquilsililo C₃-C₅, alquilamino C₁-C₅, haloalquilamino C₂-C₅, cicloalquilamino C₃-C₆, dialquilamino C₂-C₅ o halodialquilamino C₃-C₅; o

dos R² unidos a átomos de carbono de anillo adyacentes se toman juntos formando un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado de 5 a 7 miembros, opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

cada R³ es independientemente H, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -CHO, -NHCHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, hidroxilo, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, haloalquilcarbonilo C₂-C₅, cicloalquilcarbonilo C₄-C₇, alcoxicarbonilo C₂-C₆, haloalcoxicarbonilo C₂-C₆, cicloalcoxicarbonilo C₄-C₇, alcoxialquilcarbonilo C₃-C₆, alcoxialcoxicarbonilo C₃-C₆, (alquiltio)carbonilo C₂-C₆, alcoxi(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₇, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₆, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₆, alcoxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilaminosulfonilo C₁-C₅, trialquilsililo C₃-C₅ o halotrialquilsililo C₃-C₅;

cada R⁴ es independientemente H, ciano, amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o benzoilo;

cada R^{5a} y R^{5b} es independientemente alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₅, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅ o haloalcoxi C₁-C₅;

cada R⁶ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o bencilo;

cada R^{6a} es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o alquilocicloalquilo C₄-C₇;

J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno; o

J es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno;

cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alcoxialcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆ o trialquilsililo C₃-C₆; R⁸ es alquilo C₁-C₃;

R¹ es H, -NR^{9a}R^{9b}, -NR¹⁰-NR^{11a}R^{16b}, -OR¹², -N=CR^{13a}R^{13b} o -NR¹⁰N=CR^{14a}R^{14b};

cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₂-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-C₁₀, alcoxialquenilo C₃-C₁₀, alcoxialquinilo C₃-C₁₀, dialcoxialquilo C₃-C₁₀, trialcoxialquilo C₄-C₁₀, haloalcoxialquilo C₂-C₁₀, alcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, haloalcoxihaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfonilalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcoxialcoxicarbonilo C₂-C₁₀, haloalcoxicarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcoxicarbonilo C₄-C₁₀, alcoxialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcoxialcoxicarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcoxi(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcoxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, haloalcoxi C₁-C₁₀, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₀, cicloalquilsulfonilo C₃-C₁₀, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₀, dialquilaminosulfonilo C₂-C₁₀ o -(CR^{15a}R^{15b})_mR¹⁶;

- 5 cada R^{9b} y R^{11b} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinilalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcoxycarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxycarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxycarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxycarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxiti(carbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , dialquilamino(ti(carbonilo)) C_3-C_{10} , alquilsulfonylaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonylaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoxialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilsulfonyl C_1-C_{10} , haloalquilsulfonyl C_1-C_{10} , cicloalquilsulfonyl C_3-C_{10} , alquilaminosulfonyl C_1-C_{10} , dialquilaminosulfonyl C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$; o
- 10
- 15 cada pareja de R^{9a} y R^{9b} , o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de carbono y heteroátomos, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, $-CN$, alquilo C_1-C_2 y alcoxialquilo C_1-C_2 ;
- 20
- 25 R^{12} es H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_2-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinilalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcoxycarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxycarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxycarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxycarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxiti(carbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , dialquilamino(ti(carbonilo)) C_3-C_{10} , alquilsulfonylaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonylaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoxialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;
- 30
- 35 cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxialquilo C_1-C_5 ; o una pareja geminal de R^{15a} y R^{15b} se toman junto con el átomo de carbono al que está unida formando $-C(=O)-$ o un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ; o
- 40 R^{15a} y R^{15b} unidos a átomos de carbono adyacentes se toman junto con los átomos de carbono a los que están unidos formando un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ;
- 45 cada R^{16} es independientemente fenilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno; con la condición de que cuando R^{12} es $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$ y m es 0, entonces R^{16} es distinto de cicloalcoxi C_3-C_8 o cicloalquenilo C_3-C_8 ;
- 50
- 55 cada R^{17} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquiltioalquilo C_4-C_{10} , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , ciano, nitro, alcoxialquilo C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , halocicloalcoxi C_3-C_8 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfonyl C_1-C_6 , alquilsulfonyl C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfonyl C_1-C_6 , haloalquilsulfonyl C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_6 , fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;
- cada m es independientemente 0, 1 o 2;
- cada R^{10} es independientemente H, alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_5 , haloalquenilo C_2-C_5 , haloalquinilo C_2-C_5 , alcoxialquilo C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 o alcoxialquilo C_1-C_5 ;
- 55
- cada R^{13a} y R^{13b} es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquiltioalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilo C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilaminoalquilo C_2-C_6 ,

haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₆, halodialquilaminoalquilo C₃-C₆, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₅-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, cicloalquiltio C₃-C₁₀, trialquilsililo C₃-C₁₀ o halotrialquilsililo C₃-C₁₀; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en C₁-C₃ alquilo, halógeno, -CN y C₁-C₃ alcoxi; o

R^{13a} y R^{13b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₂;

cada R^{14a} y R^{14b} es independientemente H, -CN, -C(=O)OR¹⁸, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilaminoalquilo C₂-C₆, haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₆, halodialquilaminoalquilo C₃-C₆, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₅-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, cicloalquiltio C₃-C₁₀, trialquilsililo C₃-C₁₀ o halotrialquilsililo C₃-C₁₀; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₃, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₃; o

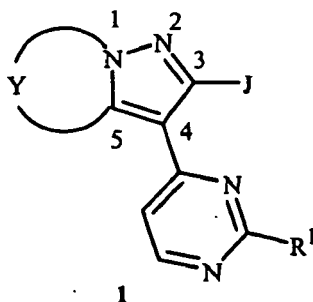
R^{14a} y R^{14b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₂ alcoxi;

p y q son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de S(=O)_p(=NR⁴)_q, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2; y

cada R¹⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o alquilcicloalquilo C₄-C₇; y (b) al menos otro fungicida.

13. Una composición fungicida que comprende (a) una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de la reivindicación 1; y (b) al menos otro componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

14. Un procedimiento para controlar enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o a una porción de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz desde el punto de vista fungicida de un compuesto de Fórmula 1, N-óxidos y sales del mismo,



en la que

Y se toma junto con los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos formando un anillo heterocíclico no aromático condensado de 5 a 7 miembros, incluyendo los miembros de anillo, además de los átomos de nitrógeno y carbono enlazantes contiguos, seleccionados del grupo que consiste en C(R²)₂, O, S, NR³, -C(R²)=C(R²)-, -C(R²)=N-, -N=N-, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), S(=O)_p(=NR⁴)_q y SiR^{5a}R^{5b},

cada R² es independientemente H, halógeno, ciano, hidroxilo, -CHO, -NHCHO, -N₃, -N=C=O, -N=C=S, -SH, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, cicloalcoxi C₃-C₆, alquilenilo C₂-C₅, haloalquilenilo C₃-C₅, alquilenilo C₂-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅,

- alquilcarboniloxi C₂-C₅, haloalquilcarboniloxi C₂-C₅, alcocicarbonilalcoxi C₃-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₅, alquilsulfonilo C₁-C₅, haloalquilsulfonilo C₁-C₅, cicloalquilsulfonilo C₃-C₆, trialquilsililo C₃-C₅, halotrialquilsililo C₃-C₅, alquilamino C₁-C₅, haloalquilamino C₂-C₅, cicloalquilamino C₃-C₆, dialquilamino C₂-C₅ o halodialquilamino C₃-C₅; o
- dos R² unidos a átomos de carbono de anillo adyacentes se toman juntos formando un anillo carbocíclico o heterocíclico condensado de 5 a 7 miembros, opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;
- cada R³ es independientemente H, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHCN, -CHO, -NHCHO, -C(=O)OR⁶, -C(=O)NHOR^{6a}, hidroxilo, alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alquilcarbonilo C₂-C₅, haloalquilcarbonilo C₂-C₅, cicloalquilcarbonilo C₄-C₇, alcocicarbonilo C₂-C₆, haloalcoxicarbonilo C₂-C₆, cicloalcoxicarbonilo C₄-C₇, alcocialquilcarbonilo C₃-C₆, alcocialcoxicarbonilo C₃-C₆, (alquiltio)carbonilo C₂-C₆, alcoxi(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₇, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₆, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₆, alcoxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₅, haloalcoxi C₁-C₅, alquiltio C₁-C₅, haloalquiltio C₁-C₅, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilaminosulfonilo C₁-C₅, trialquilsililo C₃-C₅ o halotrialquilsililo C₃-C₅;
- cada R⁴ es independientemente H, ciano, amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o benzoilo;
- cada R^{5a} y R^{5b} es independientemente alquilo C₁-C₅, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₅, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₇, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅ o haloalcoxi C₁-C₅;
- cada R⁶ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o bencilo;
- cada R^{6a} es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o alquilocicloalquilo C₄-C₇;
- J es un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno; o
- J es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros de anillo átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo átomo de nitrógeno;
- cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆ o trialquilsililo C₃-C₆;
- R⁸ es alquilo C₁-C₃;
- R¹ es H, -NR^{9a}R^{9b}, -NR¹⁰-NR^{11a}R^{11b}, -OR¹², -N=CR^{13a}R^{13b} o -NR¹⁰N=CR^{14a}R^{14b};
- cada R^{9a} y R^{11a} es independientemente H, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₂-C₁₀, alcocialquilo C₂-C₁₀, alcocialcoxicicloalquilo C₃-C₁₀, alcocialquenilo C₃-C₁₀, alcocialquinilo C₃-C₁₀, dialcoxicicloalquilo C₃-C₁₀, trialcoxicicloalquilo C₄-C₁₀, haloalcoxicicloalquilo C₂-C₁₀, alcocihaloalquilo C₂-C₁₀, haloalcoxihaaloalquilo C₂-C₁₀, hidroxialquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₂-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₁₀, alquilsulfonilalquilo C₂-C₁₀, alquilaminoalquilo C₃-C₁₀, haloalquilaminoalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilaminoalquilo C₅-C₁₀, dialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, halodialquilaminoalquilo C₄-C₁₀, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₆-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilcarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilcarbonilo C₄-C₁₀, alcocicarbonilo C₂-C₁₀, haloalcoxicarbonilo C₂-C₁₀, cicloalcoxicarbonilo C₄-C₁₀, alcocialquilcarbonilo C₃-C₁₀, alcocialcoxicarbonilo C₃-C₁₀, (alquiltio)carbonilo C₂-C₁₀, alcoxi(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquil(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquiltio(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₁₀, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₁₀, dialquilaminocarbonilo C₃-C₁₀, alquilamino(tiocarbonilo) C₂-C₁₀, dialquilamino(tiocarbonilo) C₃-C₁₀, alquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, haloalquilsulfonilaminocarbonilo C₂-C₁₀, alcocxi(alquil)aminocarbonilo C₃-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, haloalcoxi C₁-C₁₀, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₀, cicloalquilsulfonilo C₃-C₁₀, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₀, dialquilaminosulfonilo C₂-C₁₀ o -(CR^{15a}R^{15b})_mR¹⁶;

- 5 cada R^{9b} y R^{11} es independientemente H, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinilalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcoxycarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxycarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxycarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxycarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxiti(carbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , dialquilamino(ti(carbonilo)) C_3-C_{10} , alquilsulfonylaminoalquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonylaminoalquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoxialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilsulfonyl C_1-C_{10} , haloalquilsulfonyl C_1-C_{10} , cicloalquilsulfonyl C_3-C_{10} , alquilaminosulfonyl C_1-C_{10} , dialquilaminosulfonyl C_2-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{15}$; o
- 10
- 15 cada pareja de R^{9a} y R^{9b} , o pareja de R^{11a} y R^{11b} se toma independientemente junto con el nitrógeno al que está unida formando un anillo de 3 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de carbono y heteroátomos, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR^3 , $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$, y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, $-CN$, alquilo C_1-C_2 y alcoxialquilo C_1-C_2 ;
- 20
- 25 R^{12} es H; alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_2-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_{10} , alcoxialquenilo C_3-C_{10} , alcoxialquinilo C_3-C_{10} , dialcoxialquilo C_3-C_{10} , trialcoxialquilo C_4-C_{10} , haloalcoxialquilo C_2-C_{10} , alcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , haloalcoxihaloalquilo C_2-C_{10} , hidroxialquilo C_2-C_{10} , cianoalquilo C_2-C_{10} , alquiltioalquilo C_2-C_{10} , alquilsulfinilalquilo C_2-C_{10} , alquilaminoalquilo C_3-C_{10} , haloalquilaminoalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilaminoalquilo C_5-C_{10} , dialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , halodialquilaminoalquilo C_4-C_{10} , cicloalquil(alquil)aminoalquilo C_6-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilcarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilcarbonilo C_4-C_{10} , alcoxycarbonilo C_2-C_{10} , haloalcoxycarbonilo C_2-C_{10} , cicloalcoxycarbonilo C_4-C_{10} , alcoxialquilcarbonilo C_3-C_{10} , alcoxialcoxycarbonilo C_3-C_{10} , (alquiltio)carbonilo C_2-C_{10} , alcoxiti(carbonilo) C_2-C_{10} , alquiltio(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_{10} , dialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} , alquilamino(ti(carbonilo)) C_2-C_{10} , dialquilamino(ti(carbonilo)) C_3-C_{10} , alquilsulfonylaminoalquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , haloalquilsulfonylaminoalquilaminocarbonilo C_2-C_{10} , alcoxialquilaminocarbonilo C_3-C_{10} o $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$;
- 30
- 35 cada R^{15a} y R^{15b} es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxialquilo C_1-C_5 ; o una pareja geminal de R^{15a} y R^{15b} se toma junto con el átomo de carbono al que está unida formando $-C(=O)-$ o un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ; o
- 40 R^{15a} y R^{15b} unidos a átomos de carbono adyacentes se toman junto con los átomos de carbono a los que están unidos formando un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ;
- 45 cada R^{16} es independientemente fenilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o sistema de anillos bicíclico naftalenilo o heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros; o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^4)$, $SiR^{5a}R^{5b}$ y $S(=O)_p(=NR^4)_q$; cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{17} en miembros de anillo átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo átomo de nitrógeno; con la condición de que cuando R^{12} es $-(CR^{15a}R^{15b})_mR^{16}$ y m es 0, entonces R^{16} es distinto de cicloalcoxi C_3-C_8 o cicloalquenilo C_3-C_8 ;
- 50 cada R^{17} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquiltioalquilo C_4-C_{10} , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , ciano, nitro, alcoxialquilo C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , halocicloalcoxi C_3-C_8 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilsulfonyl C_1-C_6 , alquilsulfonyl C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfonyl C_1-C_6 , haloalquilsulfonyl C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_6 , fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;
- 55 cada m es independientemente 0, 1 o 2;
- cada R^{10} es independientemente H, alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_5 , haloalquenilo C_2-C_5 , haloalquinilo C_2-C_5 , alcoxialquilo C_2-C_5 , alquilcarbonilo C_2-C_5 o alcoxialquilo C_1-C_5 ;
- cada R^{13a} y R^{13b} es independientemente H, $-CN$, $-C(=O)OR^{18}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquiltioalquilo C_4-C_{10} , alquiltioalquilo C_4-C_{10} , alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_6 , fenilo, naftalenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros;

- haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₆, halodialquilaminoalquilo C₃-C₆, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₅-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, cicloalquiltio C₃-C₁₀, trialquilsililo C₃-C₁₀ o halotrialquilsililo C₃-C₁₀; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} y S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₃, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₃; o
- R^{13a} y R^{13b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₂;
- cada R^{14a} y R^{14b} es independientemente H, -CN, -C(=O)OR¹⁸, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₃-C₈, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilaminoalquilo C₂-C₆, haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₆, halodialquilaminoalquilo C₃-C₆, cicloalquil(alquil)aminoalquilo C₅-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, cicloalquiltio C₃-C₁₀, trialquilsililo C₃-C₁₀ o halotrialquilsililo C₃-C₁₀; o un anillo fenilo o heteroaromático de 5 o 6 miembros, un sistema de anillos bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo no aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, que opcionalmente incluye miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido en miembros de anillo carbono con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₃, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₃; o
- R^{14a} y R^{14b} se toman junto con el carbono al que están unidos formando un anillo de 3 a 6 miembros, incluyendo dicho anillo opcionalmente miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en NR³, C(=O), C(=S), C(=NR⁴), SiR^{5a}R^{5b} o S(=O)_p(=NR⁴)_q y opcionalmente sustituido en los miembros de anillo carbono con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN y alcoxi C₁-C₂;
- p y q son independientemente 0, 1 o 2, en cada caso de S(=O)_p(=NR⁴)_q, con la condición de que la suma de p y q es 0, 1 o 2; y
- cada R¹⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o alquilocicloalquilo C₄-C₇.