



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

**ESPAÑA** 



11) Número de publicación: 2 443 154

(51) Int. CI.:

C07D 239/42 (2006.01) **C07D 239/94** (2006.01) A01N 43/54 (2006.01) **C07D 417/12** (2006.01) A01N 43/90 (2006.01) **C07D 487/04** (2006.01) A01N 47/02 (2006.01) **C07D 495/04** (2006.01) A01N 47/24 (2006.01) **CO7F 7/10** A01N 55/00 A61P 3/00 (2006.01) A61P 5/00 (2006.01) A61P 7/02 (2006.01) A61P 7/04

(2006.01)

(12)

# TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- (96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 15.07.2010 E 10799897 (3) (97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: 25.12.2013 EP 2455371
- (54) Título: Derivados de 4-(3-butinil) aminopirimidina como agentes pesticidas para uso agrícola y hortícola
- (30) Prioridad:

16.07.2009 JP 2009168286 27.04.2010 JP 2010101951

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: 18.02.2014

(73) Titular/es:

**SDS BIOTECH K. K. (100.0%)** 1-5 Higashi-Nihombashi 1-chome Chuo-ku Tokyo 103-0004, JP

(72) Inventor/es:

SAKAI, MASAAKI; MATSUMURA, TOMOAKI; MIDORIKAWA, SATOHIRO; NOMOTO, TAKASHI; KATSUKI, RYUTARO y MURAKI, TOMOKO

(74) Agente/Representante:

**UNGRÍA LÓPEZ, Javier** 

# **DESCRIPCIÓN**

Derivados de 4-(3-butinil) aminopirimidina como agentes pesticidas para uso agrícola y hortícola

#### 5 Campo técnico

La presente invención se refiere a un novedoso derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina útil como agente pesticida, y en concreto, como agente pesticida para uso agrícola y hortícola

#### 10 Antecedente de la técnica

Hasta la fecha, se ha sabido de diversos derivados de aminopirimidinas que tienen actividad pesticida. Consulte la lista de citas que se muestra a continuación para algunos ejemplos de dichos derivados de aminopirimidinas.

En los últimos años, sin embargo, una disminución en los efectos medicinales debido a que el desarrollo de resistencia farmacológica a los agentes pesticidas ha producido un grave problema. De esta manera, sigue siendo deseable desarrollar un novedoso compuesto que se use en vez de los compuestos de aminopirimidina convencionales que tienen actividad pesticida. El derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina de la presente invención es un compuesto novedoso, y no se sabía que este compuesto tuviera actividad para controlar plagas agrícolas y hortícolas.

### Documentos de la técnica anterior

#### Documentos de patente

25

30

Documento de Patente 1: Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público Nº 5-230036 Documento de Patente 2: Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público Nº 6-25187 Documento de Patente 3: Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público Nº 8-113564 Documento de Patente 4: Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público Nº 11-302261 Documento de Patente 5: Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público Nº 11-158161 Documento de Patente 6: Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público Nº 2006-8542

Documento de Patente 7: WO2007/135029 Documento de Patente 8: WO2007/46809 Documento de Patente 9: WO2006/47397

35

# Documentos no de patente

Documento no de patente 1: Journal of the Chemical Society, 1995, pp. 3478-3481

# 40 Sumario de la invención

# Problemas que se van a resolver mediante la invención

Es un objeto de la presente invención proporcionar un novedoso derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina, un método para producir el mismo, y un agente pesticida para uso agrícola y hortícola, que comprende el derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina como ingrediente activo.

# Medios para resolver los problemas

- Como resultado de intensos estudios dirigidos a conseguir el objeto anteriormente mencionado, los presentes inventores han encontrado un derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina, que es un novedoso compuesto, tiene una significativa actividad de destrucción de insectos, ácaros, nematodos y hongos agrícolas y hortícolas, y han llevado a cabo la presente invención basándose en dichos hallazgos.
- 55 Es decir, la presente invención es de la siguiente.

Una primera invención se refiere a un derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la siguiente fórmula general [I]:

[donde R<sup>1</sup> se selecciona de entre

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

a) un anillo monocíclico o bicíclico que puede contener de 0 a 3 heteroátomos seleccionados entre el grupo que consiste en fenilo, bencilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, benzofurilo, isobenzofurilo, dihidrobenzofurilo, tiazolilo, isotiazolilo, naftilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinoxalilo, quinazolinilo, piridilo, quinolilo, isoquinolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, pirrolilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, tienilo, benzotienilo, imidazolilo, bencimidazolilo, pirazolilo, y piridonilo,

b) alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alguinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono, o cicloalquenilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono,

c) -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representa cada uno un alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes), y

d) un átomo de hidrógeno, donde

en el caso de a) o b) anteriores, se puede sustituir R<sup>1</sup> con -C(O)OR, -C(O)R, -R, -OR, -SR, -SO<sub>2</sub>R, -OC(O)R, -C(O)NHR, - C(O)NR<sub>2</sub>, -NHSO<sub>2</sub>R, -NRSO<sub>2</sub>R, -NHR, -NR<sub>2</sub>, -NHC(O)R, -NRC(O)R, - NHC(O)OR, -NRC(O)OR, -NRC(O)OR N(OR)C(O)OR, -NHSO<sub>2</sub>R, -NRSO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>NHR, -SO<sub>2</sub>NR<sub>2</sub> (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alguenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono. alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes), haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), haloalquenilo (un grupo alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 4 átomos de halógeno), haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), acilalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos acilo representados por -CO- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), aciloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con un grupo aciloxi representado por de 1 a 2 grupos -CO-O- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), alquilsulfonilalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con de 1 a 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), siloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituventes)), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con de 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), haloalcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono sustituidos con de 1 a 2 grupos haloalcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), alquiltioalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con de 1 a 2 grupos alquiltio lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), dialcoxiacetal (un grupo dialcoximetilo en el que dos grupos alcoxi lineales o ramificados conteniendo cada uno de 1 a 8 átomos de carbono están sustituidos con grupos metilo), alcoxialcoxi (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con de 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), cianoalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos ciano), halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, pentahalosulfanilo, bencilo, benciloxi, fenilo, fenoxi, piridilo, oxazolilo, furilo, tiazolilo, naftilo, pirimidinilo, tienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzodioxolilo, imida, formilo (-CHO), carboxilo (-COOH), formamida (-NHCHO), éter cíclico, y amina cíclica,

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, -R, -OR, -C(O)OR, -C(O)NHR, -CONR<sub>2</sub> (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo), haloalcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono sustituidos con 1 a 2 grupos haloalcoxi lineales o ramificados que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), fenilo, heteroarilo, halógeno, ciano, haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 9 átomos de halógeno), o haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno),

R³ representa (1) un átomo de hidrógeno, (2) un átomo de halógeno, (3) alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con aciloxi representado por de 1 a 2 grupos –CO-O- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), de 1 a 13 átomos de halógeno, o de 1 a 4 grupos hidroxilo, (4) alquilo no sustituido que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, (5) -OR, - SR, o -SO<sub>2</sub>R (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono, o (6) haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), y R⁴ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, nitro, amino, fenilo, bencilo, o junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R³ forma un anillo de tiofeno, un anillo de pirimidina, un anillo de furano, un anillo de pirazina, un anillo de benceno, un anillo de pirazina, un anillo de

Además, una segunda invención se refiere a un método para producir el derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la fórmula general [I].

Además, una tercera invención se refiere a un agente pesticida que comprende, como principio(s) activo(s), uno o dos o más de los derivados de 4-(3-butinil) aminopirimidina representados por la fórmula general [l].

# Efectos ventajosos de la invención

pirazol o un anillo de oxazol.

5

10

15

20

30

35

40

45

55

60

El novedoso derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la fórmula general [I] de la presente invención tiene un excelente efecto de control sobre las plagas, y particularmente, sobre las plagas agrícolas y hortícolas.

### Descripción de las realizaciones

A partir de ahora en el presente documento, se describirá en detalle la presente invención.

El derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina de la presente invención anteriormente descrito incluye las sales del mismo (una sal de sodio, una sal de potasio, una sal de magnesio, una sal de calcio, una sal de aluminio, etc.), y sustancias tales como un hidrato, un solvato y un polimorfismo cristalino, así como el derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la fórmula general [I]. Además, el compuesto de la presente invención (el derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la fórmula general [I]) incluye también todos los posibles estereoisómeros, y las mezclas que comprenden dos o más de dichos isómeros en cualquier relación dada.

Diversos sustituyentes representados por el compuesto [l] anteriormente descrito son de la siguiente forma.

- 50 R<sup>1</sup> es un sustituyente seleccionado entre uno cualquiera de los siguientes a) a d).
  - a) Un grupo que tiene, como enlace, cualquier átomo de anillo dado (un átomo de carbono o heteroátomo) que constituye un anillo monocíclico o bicíclico que puede contener de 0 a 3 heteroátomos seleccionados entre el grupo que consiste en fenilo, bencilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, benzofurilo, isobenzofurilo, dihidrobenzofurilo, tiazolilo, isotiazolilo, naftilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinoxalilo, quinazolinilo, piridilo, quinolilo, isoquinolilo, benzotiazolilo, benzosotiazolilo, pirrolilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzimidazolilo, pirazolilo, y piridonilo.
  - b) Alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono, o cicloalquenilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono.
  - c) -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representa cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes).
- En el caso de a) o b) anteriores, R¹ puede estar sustituido con -C(O)OR, -C(O)R, -R, -OR, -SR, -SO2R -OC(O)R, -C(O)NHR, -C(O)NR2, -NHSO2R, -NRSO2R, -NHR, -NR2, -NHC(O)R, -NRC(O)R, NHC(O)OR, -NRC(O)OR, -NRC(O

N(OR)C(O)OR, -NHSO2R, -NRSO2R, -SO2NHR, -SO2NR2 (donde R representa alguilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono),  $-SiR^5R^6R^7$ ,  $-OSiR^5R^6R^7$  (donde  $R^5$ ,  $R^6$  and  $R^7$  representa cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes), haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), haloalquenilo (un grupo alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 4 átomos de halógeno), haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), acilalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos acilo representado por -CO- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono)), aciloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos que está sustituido con 1 a 2 grupos aciloxi representados por (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono)-CO-O-), alquilsulfonilalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), siloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo, dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes)), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), haloalcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con un grupo haloalcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), alquiltioalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquiltio lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), dialcoxiacetal (un grupo dialcoximetilo en el que dos grupos alcoxi lineales o ramificados conteniendo cada grupo 1 a 8 átomos de carbono están sustituidos con grupos metilo), alcoxialcoxi (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), cianoalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos ciano), halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, pentahalosulfanilo, bencilo, benciloxi, fenilo, fenoxi, piridilo, oxazolilo, furilo, tiazolilo, naftilo, pirimidinilo, tienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzodioxolilo, imida, formil(-CHO), carboxil (-COOH), formamida (-NHCHO), éter cíclico, y amina cíclica.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, -R, -OR, -C(O)OR, - C(O)NHR, -CONR<sub>2</sub> (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificado que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), haloalcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono sustituidos con 1 a 2 grupos haloalcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), fenilo, heteroarilo, halógeno, ciano, haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 9 átomos de halógeno), o haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno).

R³ representa (1) un átomo de hidrógeno, (2) un átomo de halógeno, (3) alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con aciloxi representado por de 1 a 4 grupos –CO-O (grupos hidrocarburo alifáticos lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), 1 a 13 átomos de halógeno, o 1 a 4 grupos hidroxilo, (4) alquilo no sustituido que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, (5) -OR, - SR, o -SO<sub>2</sub>R (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), o (6) haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno).

R<sup>4</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, nitro, amino, fenilo, bencilo, o un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de pirrol, un anillo de imidazol, un anillo de benceno, un anillo de naftaleno, un anillo de pirimidina, un anillo de furano, un anillo de pirazina, un anillo de pirazol o un anillo de oxazol, que se forma junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup>.

Los ejemplos del anillo monocíclico o bicíclico que puede contener de 0 a 3 heteroátomos, representados por R<sup>1</sup>, incluyen los grupos fenilo, bencilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, benzofurilo, isobenzofurilo, dihidrobenzofurilo, tiazolilo, isotiazolilo, naftilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinoxalilo, quinazolinilo, piridilo, quinolilo, isoquinolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, pirrolilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, tienilo, benzotienilo, imidazolilo, bencimidazolilo, pirazolilo y piridonilo. De estos, son preferibles los grupos fenilo, oxazolilo, tiazolilo,

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

piridilo y tienilo, y fenilo, piridilo y son más preferibles los grupos fenilo, piridilo y tiazolilo. Además, los ejemplos del sustituyente incluyen -C(O)OR, -C(O)R, -R, -OR, -SR, -SO2R, -OC(O)R, -C(O)NHR, -C(O)NR2, -NHSO2R, -NRSO2R, -NHR, -NR2, -NHC(O)R, -NRC(O)R, -NHC(O)OR, -NRC(O)OR, -N(OR)C(O)OR, - NHSO2R, -NRSO2R, -SO2NHR, -SO2NR2 (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes), haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), haloalquenilo (un grupo alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 4 átomos de halógeno), haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), acilalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos acilo representados por -CO- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono)), aciloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos aciloxi representados por un grupo -CO-O (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), alquilsulfonilalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), siloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes)), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), haloalcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con 1 a 2 grupos haloalcoxi lineales o ramificado que contienen de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), alquiltioalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquiltio lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), dialcoxiacetal (un grupo dialcoximetilo en el que dos grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen cada uno 1 a 8 átomos de carbono están sustituidos con grupos metilo), alcoxialcoxi (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), cianoalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con un grupo ciano) halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, pentahalosulfanilo, bencilo, benciloxi, fenilo, fenoxi, piridilo, oxazolilo, furilo, tiazolilo, naftilo, pirimidinilo, tienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzodioxolilo, imida, formil (-CHO), carboxil (-COOH), formamida (-NHCHO), éter cíclico, y amina cíclica. Los ejemplos preferidos del sustituyente incluyen alguilo (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, y un grupo isopropilo), alcoxi (por ejemplo un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, u un grupo isopropoxi), acilalcoxi (por ejemplo, un grupo acetilmetoxi, un grupo propionilmetoxi, y un grupo acetiletoxi), halógeno (por ejemplo a átomo de flúor, un átomo de cloro, y un átomo de bromo, ciano, haloalquilo (por ejemplo, un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, y un grupo heptafluoroisopropilo), hidroxialquilo (por ejemplo, un grupo hidroximetilo y un grupo hidroxietilo), cianoalquilo (por ejemplo, un grupo cianometilo y un grupo cianoetilo), alcoxialquilo (por ejemplo, un grupo metoximetoxi, un grupo etoximetoxi, y un grupo metoxietoxi), haloalcoxialquilo (por ejemplo, un grupo monofluorometoximetilo, un grupo difluorometoximetilo, y un grupo trifluorometoximetilo), haloalcoxi (por ejemplo, un grupo monofluorometoxi, un grupo difluorometoxi, y un grupo trifluorometoxi), un grupo benciloxi, y un grupo fenoxi.

Los ejemplos de alquilo lineal o ramificado que contienen de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono o cicloalquenilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono, representado por R<sup>1</sup>, incluye un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-hexilo, un grupo 1propenilo, un grupo 2-propenilo, y un grupo isopropenilo. De estos, son preferibles un grupo n-butilo, un grupo sbutilo, un grupo t-butilo, un grupo 1-propenilo, y un grupo isopropenilo. Los ejemplos del sustituyente incluyen -C(O)OR, -C(O)R, -R, -OR, -SR, -SO<sub>2</sub>R, -OC(O)R, -C(O)NHR, -C(O)NR<sub>2</sub>, -NHSO<sub>2</sub>R, -NRSO<sub>2</sub>R, -NHR, -NR<sub>2</sub>, -NHC(O)R, -NRC(O)R, -NHC(O)OR, -NRC(O)OR, -N(OR)C(O)OR, -NHSO<sub>2</sub>R, -NRSO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>NHR, -SO<sub>2</sub>NR<sub>2</sub> (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), -SiR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, -OSiR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>R<sub>7</sub> (donde R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes), haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), haloalquenilo (un grupo alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 4 átomos de halógeno), haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), acilalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos acilo representado por -CO- (un grupo hidrocarburo alifático

# ES 2 443 154 T3

lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono)) aciloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos aciloxi, representados por un grupo -CO-O- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), alquilsulfonilalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), siloxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R5, R6 y R7 representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes)), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 10 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), haloalcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con 1 a 2 grupos haloalcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno), alquiltioalguilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que 15 contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquiltio lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), dialcoxiacetal (un grupo dialcoximetilo en el que dos grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen cada uno 1 a 8 átomos de carbono están sustituidos con grupos metilo), alcoxialcoxi ( un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contienen de 1 a 8 átomos de carbono), cianoalquilo (un grupo alquilo lineal o 20 ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos ciano), halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, pentahalosulfanilo, bencilo, benciloxi, fenilo, fenoxi, piridilo, oxazolilo, furilo, tiazolilo, naftilo, pirimidinilo, tienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzodioxolilo, imida, formil (-CHO), carboxil (-COOH), formamida (-NHCHO), éter cíclico, y amina cíclica. Los ejemplos preferidos del sustituyente incluyen alcoxicarbonilo (por ejemplo, un grupo metoxicarbonilo y un grupo etoxicarbonilo), halógeno (por ejemplo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, y 25 un átomo de bromo), ciano, hidroxialquilo (por ejemplo, un grupo hidroximetilo y un grupo hidroxietilo), alcoxialquilo (por ejemplo, un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, y un grupo metoxietilo), haloalquilo (por ejemplo, un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, y un grupo heptafluoroisopropilo), haloalcoxi (por ejemplo, un grupo monofluorometoxi, un grupo difluorometoxi, y un grupo trifluorometoxi, haloalcoxialquilo (por ejemplo, un grupo monofluorometoximetilo, un grupo difluorometoximetilo, y un grupo trifluorometoximetilo), 30 cianoalquilo (por ejemplo, un grupo cianometilo y un grupo cianoetilo), un grupo fenilo, un grupo de piridilo, un grupo furilo, un grupo tiazolilo, y un grupo pirimidinilo.

Ejemplos del -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo, dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes) representados por R<sup>1</sup>, incluyen un grupo trimetilsililo, un grupo triisopropilsililo, un grupo t-butildimetilsililo, y un grupo t-butildifenilsililo. De estos, son preferibles un grupo trimetilsililo y un grupo de trietilsililo

R<sup>2</sup> representa de forma preferible un átomo de hidrógeno o un grupo ciano. Como alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, son preferibles un grupo metilo y un grupo etilo. Como alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos, son preferibles un grupo etinilo y un grupo propenilo.

Los ejemplos de R<sup>2</sup> incluyen -C(O)OR, -C(O)NHR, -CONR<sub>2</sub> (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), un grupo fenilo, y un grupo heteroarilo. De estos, es preferible un grupo fenilo.

Los ejemplos del átomo de halógeno representado por R<sup>2</sup> incluyen un átomo de cloro, un átomo de yodo, un átomo de bromo, y un átomo de flúor. De estos, son preferibles un átomo de cloro y un átomo de flúor.

45

65

Los ejemplos del grupo alcoxi representado por R<sup>2</sup> incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, y un grupo n-propoxi, y un grupo isopropoxi. De estos, son preferibles un grupo metoxi y un grupo etoxi.

Los ejemplos preferidos del grupo haloalquilo representado por R² incluyen un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, y un grupo trifluorometilo. Los ejemplos preferidos del grupo haloalcoxi representado por R² incluyen un grupo monofluorometoxi, un grupo difluorometoxi, y un grupo trifluorometoxi.

Los ejemplos del átomo de halógeno representado por R<sup>3</sup> incluyen un átomo de cloro, un átomo de yodo, un átomo de bromo, y un átomo de flúor. De estos, son preferibles un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de vodo.

Los ejemplos del grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 4 grupos aciloxi representado por grupos –CO-O- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), 1 a 13 átomos de halógeno o 1 a 4 grupos hidroxilo, representados por R<sup>3</sup>, incluyen un grupo clorometilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo acetiloximetilo, un grupo 1-

acetiloxietilo, un grupo 1-propioniloxietilo, y un grupo 1-hidroxietilo. De estos, son preferibles un grupo 1-cloroetilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 1-acetiloxietilo, y un grupo-hidroxietilo.

Los ejemplos preferidos del grupo alquilo no sustituido que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, representado por R<sup>3</sup>, incluyen un grupo metilo y un grupo etilo.

Los ejemplos de R<sup>3</sup> incluyen –OR, -SR, y –SO<sub>2</sub>R (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alguenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alguinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono). De estos, son preferibles un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo metiltio, y un grupo etiltio.

Los ejemplos del grupo haloalquilo representado por R<sup>3</sup> incluyen un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo heptafluoropropilo, y un grupo heptafluoroisopropilo. De estos, son preferibles un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, y un grupo trifluorometilo.

Los ejemplos del átomo de halógeno representado por R<sup>4</sup> incluyen un átomo de cloro, un átomo de yodo, un átomo de bromo, y un átomo de flúor. De estos, son preferibles un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de vodo.

20 Los ejemplos preferidos del grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, representado por R<sup>4</sup>, incluyen un grupo metilo y un grupo etilo.

Un ejemplo del anillo de tiofeno representado por R4, que se forma junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> es un anillo representado por la siguiente fórmula general (IV-1):

> [Fórmula 2] [ IV-1 ]

(donde R8 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un átomo de flúor, o un átomo de cloro). Es preferible un anillo de tieno[2,3-d] pirimidina, donde R<sup>8</sup> representa un átomo de hidrógeno o un átomo de cloro.

Un ejemplo del anillo de benceno representado por R<sup>4</sup>, que se forma junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup>, es un anillo representado por la siguiente fórmula general (IV-2):

> [Fórmula 3] [ IV-2 ]

35

10

15

25

30

40

45

50

(donde R8 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metoxi, un grupo trifluorometilo, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo metiltio, un grupo propargilo, un grupo propargiloxi, un grupo bencilo, un grupo benciloxi, un grupo heteroarilo, o un grupo fenilo). Es preferible un anillo de quinazolina, donde R<sup>8</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro.

El término "alquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos de dicho grupo alquilo incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo s-butilo, un grupo tbutilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo neopentilo, un grupo n-hexilo, n-octilo.

El término "alquenilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos de dicho grupo alquenilo incluyen un grupo etenilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo isopropenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, y un grupo 3-butenilo.

# ES 2 443 154 T3

El término "alquinilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos de dicho grupo alquinilo incluyen un grupo etinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, y un grupo 3-butinilo.

- El término "cicloalquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos de dicho grupo cicloalquilo incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, y un grupo ciclohexilo.
- El término "cicloalquenilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo cicloalquenilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos de dicho grupo cicloalquenilo incluyen un grupo 1-ciclopentilo, un grupo 2-ciclopentilo, un grupo 3-ciclopentilo, un grupo 1-ciclopentilo, un grupo 2-ciclopentilo, y un grupo 3-ciclopentilo.
- El término "heteroátomo" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno, y un átomo de azufre.
  - El término "halógeno" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir flúor, cloro, bromo, y yodo.
- El término "halo..." (por ejemplo, "haloalquilo") se usa en la invención de la presente solicitud para incluir flúor, cloro, bromo, y yodo.
  - El término "haloalquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 9 átomos de halógeno. Los ejemplos de dicho haloalquilo incluyen un grupo monofluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo monobromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo pentafluoropropilo, y un grupo isoheptafluoropropilo.
  - El término "haloalquenilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono que está sustituido de forma idéntica o diferente con de 1 a 4 átomos de halógeno. Los ejemplos de dicho haloalquenilo incluyen un grupo 1,2-difluoroetenilo, un grupo 2,2-difluoroetenilo, y un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo.
- El término "alcoxi" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo (alquil)-O-, la porción alquilo del cual tiene los significados anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alcoxi incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, y un grupo t-butoxi.
  - El término "haloalcoxi" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo (haloalquil)-O-, la porción haloalquilo del cual tiene los significados anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho haloalcoxi incluyen un grupo monofluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, y un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi.
  - Todo lo relacionado con el término "acilo", el término "acilo" ben acilalcoxi, el término "acilo" en aciloxialquilo, y el término "acilo" en aciloxi se usan en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo representado por CO- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono). Los ejemplos de dicho grupo incluyen un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butirilo y un grupo isobutirilo. Debe señalarse que el grupo hidrocarburo alifático significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, y cicloalquinilo en la presente solicitud.
- El término "acilalcoxi" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos acilo descritos anteriormente. Ejemplos de dicho acilalcoxi incluyen un grupo acetilmetoxi, un grupo acetiletoxi, y un grupo acetilpropoxi.
- El término "aciloxi" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo –CO-O- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono). Los ejemplos de dicho aciloxi incluyen un grupo acetoxi, un grupo propioniloxi, un grupo isopropioniloxi, y un grupo pivaloiloxi.
  - El término "aciloxialquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos acilo anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho aciloxialquilo incluyen un grupo acetoximetilo, un grupo acetoxietilo, y un grupo acetoxipropilo.
  - El término "alquilsulfonilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo (alquil)-SO<sub>2</sub>-, la porción alquilo del cual tiene los significados anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alquilsulfonilo incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, y un grupo isopropilsulfonilo.

65

60

25

30

40

# ES 2 443 154 T3

El término "alquilsulfonilalquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquilsulfonilo anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alquilsulfonilalquilo incluyen un grupo metilsulfonilmetilo, un grupo metilsulfoniletilo, y un grupo metilsulfonilpropilo.

5

El término "siloxi" se usa en la invención de la presente solicitud para significar -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes). Los ejemplos de dicho siloxi incluyen un grupo trimetilsiloxi, un grupo trietilsiloxi, un grupo triisopropilsiloxi, un grupo tbutildimetilsiloxi, y un grupo t-butildifenilsiloxi.

15

10

El término "siloxialquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con el grupo siloxi anteriormente descrito. Los ejemplos de dicho siloxialquilo incluyen un grupo trimetilsiloximetilo, un grupo trimetilsiloxietilo, un grupo trimetilsiloxipropilo, un grupo trietilsiloximetilo, y un grupo t-butildimetilsiloximetilo.

El término "hidroxialquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo. Los ejemplos de dicho hidroxialquilo incluyen un grupo hidroximetilo, un grupo hidroxietilo, y un grupo hidroxipropilo.

20

El término "alcoxialquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxilo anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alcoxialquilo incluyen un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo propoximetilo, y un grupo isopropoximetilo.

25

El término "alquiltio" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo (alquil)-S-, la porción alquilo del cual tiene los significados anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alquiltio incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, y un grupo propiltio.

El término "alquiltioalquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o 30 ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alquiltio anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alquiltioalquilo incluyen un grupo metiltiometilo, un grupo etiltiometilo, un grupo metiltioetilo, y un grupo etiltioetilo.

35

El término "dialcoxiacetal" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo dialcoximetilo en el que los dos grupos alcoxi anteriormente descritos están sustituidos con grupos metilo. Los ejemplos de dicho dialcoxiacetal incluyen un grupo dimetoximetilo, un grupo dietoximetilo, y un grupo dipropoximetilo.

40

El término "alcoxialcoxi" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho alcoxialcoxi incluyen un grupo metoximetoxi, un grupo metoxietoxi, y un grupo metoxipropoxi.

45

El término "haloalcoxialquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos haloalcoxi anteriormente descritos. Los ejemplos de dicho haloalcoxialquilo incluyen un grupo monofluorometoximetilo, un grupo difluorometoximetilo, y un grupo trifluorometoximetilo.

50

El término "cianoalquilo" se usa en la invención de la presente solicitud para denotar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos ciano. Los ejemplos de dicho cianoalquilo incluyen un grupo cianometilo, un grupo cianoetilo, y un grupo cianopropilo.

En la invención de la presente solicitud, "fenilo", "tienilo", "piridilo", "oxazolilo", "furanilo", "tiazolilo", "naftilo", "pirimidinilo", "benzotiazolilo", "benzooxazolilo", y "benzodioxolilo" pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes que son idénticos a o diferentes entre sí, o puede no tener dicho(s) sustituyente(s).

55

El término "fenoxi" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir un grupo fenoxi que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser idénticos a o diferentes entre sí, y un grupo fenoxi no sustituido.

El término "bencilo" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir un grupo bencilo que tiene uno o más 60 sustituyentes que pueden ser idénticos o diferentes entre sí, y un grupo bencilo no sustituido.

65

El término "benciloxi" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir un grupo benciloxi que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser idénticos a o diferentes entre sí, y un grupo benciloxi no sustituido.

El término "propargilo" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir un grupo propargilo que tiene un sustituyente en el término alquino del mismo, y un grupo propargilo no sustituido.

El término "propargiloxi" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir un grupo propargiloxi que tiene un sustituyente en el término alquino del mismo, y un grupo propargiloxi no sustituido.

El término "heteroarilo" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinoxalilo, quinazolinilo, quinolilo, isoquinolilo, indolilo, isoindolilo, imidazolilo, pirazolilo, piridilo, furilo, tienilo, y pirrolilo. Estos grupos pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes que pueden ser idénticos a o diferentes entre sí, o puede no tener dicho(s) sustituyente(s).

El término "éter cíclico" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir epoxi, oxetano, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, dioxolano, y dioxano.

15 El término "amina cíclica" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir pirrolidinilo, imidazolinilo, pirazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, y morfolinilo.

El término "imida" se usa en la invención de la presente solicitud para incluir la cadena de imida y la imida cíclica.

20 Ya que el compuesto representado por la fórmula general [l] de la presente invención tiene un grupo amino, las sales de ácido añadidas derivadas de dicho grupo amino están también incluidas en la presente invención.

Los ejemplos de un ácido que forma dichas sales de ácido incluyen: ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, y ácido fosfórico; ácidos carboxílicos tales como ácido fórmico, ácido oxálico, ácido fumárico, ácido adípico, ácido esteárico, ácido oleico, y ácido aconítico; ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico, y ácido p-toluensulfónico, y sacarina.

Además, diversos isómeros ópticos, cuerpos racémicos, y sus mezclas, que se derivan de átomos de carbono asimétricos que se generan cuando R² en el compuesto representado por la fórmula general [I] de la presente invención es -R, -OR, -C(O)OR, -C(O)NHR, -CONR₂ (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), hidroxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos hidroxilo), alcoxialquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 3 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 2 grupos alcoxi lineales o ramificados que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), fenilo, heteroarilo, halógeno, ciano, haloalquilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 9 átomos de halógeno), o haloalcoxi (un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 4 átomos de carbono que está sustituido con 1 a 9 átomos de halógeno), están incluidos todos en la presente invención.

Además, diversos isómeros ópticos, cuerpos racémicos, y sus mezclas, que se derivan a partir de átomos de carbono asimétricos que se generan cuando  $R^3$  en el compuesto representado por la fórmula general [I] de la presente invención es alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con aciloxi representado por - CO-O- (un grupo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono), un átomo de halógeno, o un grupo hidroxilo, están incluidos todos en la presente invención.

Tal como se muestra en la siguiente fórmula del procedimiento de reacción, el compuesto [I] de la presente invención, que está representado por la siguiente fórmula, se puede producir, por ejemplo, haciendo reaccionar un derivado de cloropirimidina representado por la siguiente fórmula general [II] con un derivado de 3-butinilamina representado por la siguiente fórmula general [III] en presencia de una base y un disolvente.

#### [Fórmula 4]

$$\begin{array}{c}
CI \\
R^4 \downarrow N \\
R^3 \downarrow N \\
[II]
\end{array}$$

$$+ H_2N \downarrow R^1 \\
base$$

$$+ H_1 \downarrow N \\
R^3 \downarrow N \downarrow N \\
R^3 \downarrow N \downarrow N \\
R^1 \downarrow N \\
R^2 \downarrow N \\
R^1 \downarrow N \\
R$$

(donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

55

5

10

25

30

35

40

45

El tipo del disolvente no está particularmente limitado, siempre que no esté directamente implicado en la presente reacción. Los ejemplos de dicho disolvente incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos o alicíclicos clorados o no clorados, tales como benceno, tolueno, xileno, metilnaftaleno, éter de petróleo, ligroína, hexano, clorobenceno, diclorobenceno, cloroformo, dicloroetano, y tricloroetileno, éteres tales como tetrahidrofurano, dioxano, y dietil éter, nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; compuestos de amida tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, y N-metil pirrolidona; compuestos de sulfoxi tales como dimetil sulfóxido: compuestos de urea tales como N,N-dimetilimidazolidinona, sulfolano; y mezdas de los disolventes anteriormente descritos. De estos, son preferibles los compuestos tales como N,N-dimetilformamida, N,Ndimetilacetamida y N-metil pirrolidona.

10

Se puede determinar la cantidad del disolvente, de tal manera que la cantidad del compuesto [II] puede ser del 5% al 80% en peso, y preferentemente del 10% al 70% en peso.

15

El tipo de la base usada en el presente documento no está particularmente limitado. Los ejemplos de la base incluyen bases orgánicas e inorgánicas, por ejemplo, bases orgánicas tales como aminas terciarias (trietilamina, etc.) y DBU, y bases inorgánicas tales como los hidruros, hidróxidos, carbonatos, hidrogenocarbonatos y similares de metales alcalinos y metales alcalinotérreos. De estos, son preferibles las bases orgánicas tales como las aminas terciarias (trietilamina, etc.) y DBU.

20

La base se usa en una cantidad de 1,0 a 5,0 moles, y preferentemente de 1,2 a 2,0 moles, con respecto a 1,0 moles del compuesto.

25

El compuesto [III] se usa como materia prima en una cantidad de 1,0 a 5,0 moles, y preferentemente de 1,02 a 1,2 moles, con respecto a 1,0 moles del compuesto [II].

La temperatura de reacción no está particularmente limitada. Está comprendida en un intervalo de temperatura entre la temperatura ambiente y el punto de ebullición del disolvente utilizado o inferior. Está preferentemente entre 60°C y 110° C.

30

El tiempo de reacción cambia dependiendo de la concentración y la temperatura anteriormente descritas. Es generalmente de 0,5 a 8 horas.

35

Tras la finalización de la reacción, el compuesto III que se ha producido anteriormente se somete a tratamientos posteriores ordinarios tales como extracción, concentración y filtración, y puede purificarse a continuación, según sea adecuado, mediante medios conocidos tales como recristalización o diversos tipos de cromatografía, según sea necesario.

Cuando el compuesto [I] producido de esta manera es un alquino terminal (R1 = H, compuesto I-1), se puede utilizar la reacción de Sonogashira o similar para introducir un sustituyente.

40

(donde R1 representa fenilo, heteroarilo o alquenilo, y R2, R3 y R4 tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

45

El compuesto [II] utilizado en el presente método de síntesis se puede producir, por ejemplo, mediante el método que se muestra en la siguiente fórmula, de acuerdo con el método descrito en el Documento no de patente 1.

# [Fórmula 6]

(donde R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente)

Además, se puede usar en la presente síntesis un producto comercialmente disponible como un derivado de 3-butinilamina [III]. Si es necesario, se puede producir mediante el método que se describe a continuación. Sin embargo, no se pretende que el siguiente método limite el alcance de la presente inverción.

### (Método de síntesis 1)

10

20

Se llevó a cabo la reacción de Sonogashira entre un derivado de N-(3-butinil) ftalimida [VIII] y yoduro o bromuro de fenilo, bromuro o cloruro de heteroarilo, o yoduro o bromuro de alquenilo [V]. Posteriormente, se desprotegió el producto [IX] mediante hidrazina o una base, con el fin de producir un derivado de 3-butinilamina [III].

(donde X representa yodo, bromo o cloro,  $R^1$  representa fenilo, heteroarilo o alquenilo, y  $R^2$  tiene las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

# (Método de síntesis 2)

Se sometieron alcohol butinílico [X] y ftalimida [XI] sustituidos a la reacción de Mitsunobu para sintetizar un producto [XII], y el producto sintetizado de esta manera [XII] se sometió a continuación a la reacción de Sonogashira y a continuación a desprotección de la misma manera que el método de Síntesis 1, con el fin de producir un derivado de 3-butinilamina [III].

(donde X representa yodo, bromo o cloro,  $R^1$  representa fenilo, heteroarilo o alquenilo, y  $R^2$  tiene las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

#### (Método de síntesis 3)

5

10

20

25

Se hizo reaccionar el alquino terminal [XII] con un reactivo de Grignard y a continuación se hizo reaccionar con óxido de etileno [XIII], con el fin de sintetizar un derivado de alcohol 3-butinílico [XIV]. Posteriormente, este alcohol se sometió a la reacción de Mitsunobu y a continuación a desprotección, con el fin de producir un derivado de 3-butinilamina [III].

$$R^{1} = \frac{RMgX}{R^{2}} = \frac{R^{2}}{R^{2}} = \frac{R^{2}}{R^{1}}$$
[XIII]

(donde X representa yodo, bromo o cloro, y R1 y R2 tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

#### 15 (Método de síntesis 4)

Se protegió el alcohol butinílico sustituido (X) mediante un grupo tosilo, y posteriormente, se añadió alquil litio de tal manera que se dejó que el carbono del alquino terminal generara el anión. Se introdujo un sustituyente en el carbono alquino terminal mediante una reacción de sustitución nucleofílica, a fin de producir un producto [XVI]. Posteriormente, se hizo reaccionar el producto [XVI] con ftalimida de potasio [XVII] en presencia de yoduro de potasio, con el fin de producir un producto [IX], Posteriormente, el producto [IX] se desprotegió, a fin de producir el derivado de 3-butinilamina [III].

# [Fórmula 10]

(donde X representa yodo, bromo o cloro,  $R^1$  representa trialquilsililo, y  $R^2$  tiene las mismas definiciones que los descritos anteriormente)

### (Método de síntesis 5)

5

10

15

30

35

40

Se hizo reaccionar azida de sodio con un compuesto [XVIII] formado protegiendo el alcohol butinílico sustituido [XIV] por un grupo tosilo, a fin de producir un compuesto de azida [XIV]. Posteriormente, este compuesto de azida [XIV] se redujo mediante hidruro de aluminio litio, a fin de producir un derivado de 3-butinilamina [III].

$$\begin{array}{ccc} & & & & & \\ & & & & \\ & & & & \\ & & & & \\ & & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & \\ & & \\ &$$

(donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

#### (Método de síntesis 6)

Se puede producir un derivado de 3-butinilamina [III] a partir de 4-pentilamida [XX] mediante un reordenamiento de Hofmann.

[Fórmula 12]  $H_2NOC \xrightarrow{\mathbb{R}^2} \mathbb{R}^1$   $= base, X_2$   $= H_2N \xrightarrow{\mathbb{R}^2} \mathbb{R}^1$  = [III]

(donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

# 20 (Método de síntesis 7)

Se puede producir un derivado de 3-butinilamina [III] a parir de la azida de acilo [XXI] mediante un reordenamiento de Curtius.

25 [Fórmula 13]

$$N_3OC$$
 $\begin{bmatrix} XXI \end{bmatrix}$ 
 $R^1$ 
 $H_2O$ 
 $H_2N$ 
 $\begin{bmatrix} III \end{bmatrix}$ 

(donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tienen las mismas definiciones que los descritos anteriormente).

# [Efecto de control]

El término "plaga" se utiliza en la invención de la presente solicitud para incluir todas las plagas que afectan plantas agrícolas y hortícolas, y a todos los patógenos que afectan plantas agrícolas y hortícolas.

Se proporcionan a continuación ejemplos de plagas agrícolas y hortícolas sobre las que el compuesto (I) de la presente invención muestra un efecto de control.

Los ejemplos de dichas plagas agrícolas y hortícolas incluyen: plagas que pertenecen a Lepidoptera, tales como Plutella xylostella, Agrotis ipsilon, Agrotis segetum, Helicoverpa armigera, Helicoverpa assulta, Helicoverpa zea, Heliothis virescens, Mamestra brassicae, Naranga aenescens, Plusia nigrisigna, Pseudaletia separata, Spodoptera exigua, Spodoptera littura, Spodoptera littoralis, Spodoptera frugiperda, Spodoptera eridania, Manduca sexta,

Endopiza viteana, Lyonetia prunifoliella malinella, Phyllonorycter ringoneella, Phyllocnistis citrella, Pectinophora gossypiella, Carposina niponensis, Adoxophyes orana faciata, Adoxophyes honmai, Homona magnamina, Cydla pomonella, Grapholita molesta, Chilosuppressalis, Cnaphalocrocis medinalis, Hellula undalis, Ostrinia nubilalis, Pseudoplusia includens, Trichoplusia ni, Hyphantria cunea, Pieris rapaecrucivora, y Parnara guttata; plagas que pertenecen a Coleoptera, tales como Anomala cuprea, Anomala rufocuprea, Popillia japonica, Lepinotarsa decemlineata, Epilachna varivestis, Melanotus tamsuyensis, Lasioderma serricorne, Epuraea domina, Henosepilachna vigintioctopunctata, Tenebrio molitor, Tribolium castaneum, Anoplophora malasiaca, Monochamus alternatus, Callosobruchus chinensis, Aulacophora femoralis, Oulema oryzae, Phyllotreta striolata, Cylasformicarius, Anthonomus grandis, Ethinocnemus squameus, Hypera postica, Lissorhoptrus oryzophilus, Sitophilus zeamais, 10 Sphenophrus venatus vestius, Sitophilus granarius, Diabrotica undecimpunctata, Diabrotica virgifera, Diabrotica barberi, y Paederus fuscipes; plagas que pertenecen a Hemiptera, tales como Eurydema rugosa, Eysarcoris ventralis, Halyomorpha mista, Nezara viridula, Leptocorisa chinensis, Riptortus clavatus, Togo hemipterus, Stephanitis pyrioides, Epiacanthus stramineus, Empoasca onukii, Empoasca fabae, Nephotettix cinctinceps, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Sogatella furcifera, Trioza erytreae, Psylla pyrisuga, Bemisia tabaci, 15 Bemisia argentifolii, Dialeuro descitri, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Aphis pomi, Myzus persicae, Drosicha corpulenta, Icerya purchasi, Planococcus citri, Pseudococcus comstocki, Ceroplastes rubens, Unaspis yanonensis, y Cimex lectularius; plagas que pertenecen a Thysanoptera, tales como Frankliniella occidentalis, Frankliniella intonsa, Scirtothrips dorsalis, Thrips palmi, y Thrips tabaci; plagas que pertenecen a Diptera, tales como Dacus dorsalis, Dacus cucurbitae, Ceratitis capitata, Hydrellia griseola, Liriomyza bryoniae, Liriomyza trifolii, Hylemya 20 platura, Rhagoletis pomonella, Mayetiola destructor, Musca domestica, Stomoxys calcitrans, Melophagus ovinus, Hypoderma lineatum, Hypoderma bovis, Oestrus ovis, Glossina palpalis, Glossina morsitans, Prosimulium yezoensis, Tabanus trigonus, Telmatoscopus albipunctatus, Leptoconops nipponensis, Culex pipiens pallens, Aedes albopicutus, Aedes aegypti, y Anopheles hyracanus sinesis; plagas que pertenecen a Hymenoptera, tales como Apethymus kuri, Athalia rosae japonensis, Neodiprion sertifer, Eciton burchelli, Eciton schmitti, Camponotus japonicus, Vespa mandarina, Myrmecia spp., Solenopsis spp., y Monomorium pharaonis; plagas que pertenecen a 25 Dictyoptera, tales como Periplaneta fuliginosa, Periplaneta japonica, y Blattella germanica; plagas que pertenecen a Orthoptera, tales como Teleogryllus emma, Gryllotalpa africana, Locusta migratoria, Oxya yezoensis, y Schistocerca gregaria; plagas que pertenecen a Isoptera, tales como Coptotermes formosanus, Reticulitermes speratus, y Odontotermes formosanus; plagas que pertenecen a Isoptera, tales como Ctenocephalidae felis, Pulex irritans, y 30 Xenopsylla cheopis; plagas que pertenecen a Mallophaga, tales como Menacanthus stramineus y Bovicola bovis; plagas que pertenecen a Anoplura, tales como Haematopinus eurysternus, Haematopinus suis, Linognathus vituli, y Solenopotes capillatus; Tetranychidae tales como Panonychus citri, Panonychus ulmi, Tetranychus kanzawai, y Tetranychus urticae; Eriophyidae tales como Acaphylla theae, Aculops pelekassi, Eriophyes chibaensis, y Aceria tulipae; Tarsonemidae tales como Polyphaotarsonemus latus y Steneotarsonemus pallidus; Acaridae tales como 35 Tyrophagus putrescentiae y Rhizoglyphus robini; Varroa tales como Varroa jacobsoni; Ixodidae tales como Boophilus microplus y Haemaphysalis longicornis; Psoroptidae tales como Psoroptes ovis; Sarcoptidae tales como Sarcoptes scabiei: Crustacea tales como Armadillidium vulgare; Nematoda tales como Prathylenchus penetrans. Prathylenchus Globodera rostochiensis, Heterodera glycines, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, y Bursaphelenchus lignicolus; y Mollusca tales como Ponacea canaliculata, Incilaria bilineata, Acusta despecta 40 sieboldiana, y Euhadra peliomphala.

Los ejemplos de patógenos agrícolas y hortícolas incluyen Pyricularia oryzae, Cochliobolus miyabeanus, Rhizoctonia solani, Gibberella fujikuroi, Erysiphe graminis f.sp. tritici, Erysiphe graminis f.sp. hordei, Pseudocercosporella herpotrichoides, puccinia graminis, Colletotrichum graminicola, Septoria tritici, Phynchosporium secalis f.sp. hordei, 45 Phytophthora infestans, Alternari solani, Colletotrichum atramentarium, Thanatephorus cucumeris, Botrytis cinerea, Erisiphe pisi, Cercospora canescens, Sclerotinia sclerotiorum, Colletotrichum phaseolorum, Colletotrichum lindemuthiamum, Colletotrichum truncatum, Cercospora kikuchii, Phakopsora pachyrhizi, Gloeosporium conjac, Septoria perillae, Colletotrichum theae-sinensis, Cercospora beticola, Colletotrichum spinaciae, Peronospora effusa, brassicae. Alternaria brassicicola, Colletotrichum higginsianum, Alternaria Pseudoperonospora cubensis, Sphaerotheca fuliginea, Phytophthora melonis, 50 Corynespora cassiicola, Colletotrichum lagenarium, Fusarium oxysporum f.sp. cucumerinum, Phythium cucurbitacearum, Rhyzoctonia solani, Phomopsis sp., Phytophthora cryptogea, Colletotrichum orbiculare, Fusarium oxysporum f.sp. melonis, Fusarium oxysporum, Puccinia cnici-oleracei, Gloeosporium chrysanthemi, Gloeosporium carthami, Erysiphe heraclei, Sclerotinia intermedia, Alternaria dauci, Alternaria radicina, Oidiopsis sicula, Phytophthora capsici, Colletotrichum gloeosporioides, Fusarium oxysporum f.sp. lycopersici, Fulvia fulva, Alternaria solani, Verticillium dahliae, 55 Sphaerotheca humuli, Phytophthora nicotianae, Phytophthora nicotianae var. parasitica, Pythium ultimum var. ultimum, Alternaria alternata, Mycosphaerella fragariae, Colletotrichum acutatum, Glomerella cingulata, Cercospora asparagi, Phomopsis asparagi, Puccinia asparagi-lucidi, Cladosporium allii-cepae, Fusarium oxysporum f.sp. cerae, Septoria alliacea, Alternaria porri, Puccinia allii, Botrytis squamosa, Phytophthora parri, Colletotrichum circinans, Alternaria sp., Botrytis allii, Pleospora herbarum, Peronospora destructor, Botrytis byssoidea, Mycosphaerella 60 allicina, Septria alliacea, Sclerotinia allii, Phythoththora parri, Phyllactinia kakikola, Colletotrichum ssp., Glomerella sp., Cercospora kakivora, Cercosporakaki, Macrophoma kaki, Fusicladium levieri, Phomopsis kakivora, Pseudocercospora fuliginosa, Physalospora kaki, Aureobasidium pullulans, Capnophaeum fuliginodes, Cladosporium herbarum, Microxyphium sp., Scorias communis, Tripospermum juglandis, Zygophiala jamaicensis, Gloeosporium kaki. Pestalotia diospyri, Mycosphaerella nawae, Podosphaera tridactyla, Sphaerotheca pannosa, Botryosphaeria dothidea, Cladosporium carpophilum, Leucotelium pruni-persicae, Rosellinia necatrix, Fusarium lateritium, Japanese

apricot Pseudocercospora circumscissa, Sphaceloma pruni-domesticae, Monilinia fructicola, Monilinia laxa, Glomerella mume, Rhizopus nigricans, Phyllactinia mali, Phytophthora cactorum, phytophthora syringae, Venturia pirina, Gymnosporangium asiaticum, Phyllactinia pyri, Venturia nashicola, Alternaria kikuchiana, Leptothyrium pomi, Monilinia fructigena, Physalospora piricola, Gibberella zeae, Stenella sp., Phyllosticta persicae, Gloeosporium laeticolor, Phomopsis sp., Gymnosporangium yamadae, Podosphaera leucotricha, phytophthora cambivola, Diplocarpon mali, Cristulariella moricola, Venturia inaequalis, Uncinula necator, Pseudocercospora vitis,Briosia ampelophaga, Elsinoe ampelina, Phyllosticta ampelicida, Phomopsis viticola, Plasmopara viticola, Capnodium salicinum, Morenoella quercina, Microsphaera alphitoides, Monochaetia monochaeta, Phytophthora citrophthora, Diaporthe citri, Mycosphaerella citri, Mycosphaerella horii, Elsinoe fawcettii y Mycosphaerella pinodes.

10

15

20

#### [Agentes de control de plagas]

El agente de control de plagas para uso agrícola y hortícola de la presente invención tiene especialmente efecto fungicida y efecto insecticida. El presente agente de control de plagas comprende uno o dos o más del (de los) compuesto(s) representados por la formula general [I] como ingrediente(s) activo(s).

El compuesto representado por la fórmula general [I] de la presente invención se puede aplicar en el tratamiento de plantas mediante pulverización, dispersión o revestimiento del ingrediente activo del mismo, o tratando las semillas de plantas, el suelo que rodea las plantas o el suelo en el que las semillas se han diseminado, arrozales, y el agua del agua de cultivo, con el ingrediente activo del mismo. Cuando el compuesto de la presente invención se utiliza como fungicida, se puede aplicar antes o después de la infección de plantas con patógenos. Cuando el compuesto de la presente invención se utiliza como insecticida, se puede aplicar antes de que se generen plagas y similares, o después de haberse generado dichas plagas.

El presente compuesto se puede utilizar como un agente que es adecuado como agente de control de plagas para uso agrícola y hortícola, tales como un gránulo, una mezcla de polvo-gránulo, un polvo soluble en agua, una disolución oleosa, una emulsión, una microemulsión, una suspoemulsión, una formulación líquida, un polvo humectable, un concentrado emulsionable, un concentrado para suspensión, un comprimido, un gránulo dispersable en agua, una microcápsula, un aerosol, una pasta, un agente *jumbo*, un polvo para empolvado, un agente productor de humo y un agente para fumigación, que son formas de formulación habituales. Los agentes que tienen las formas anteriormente descritas se pueden obtener mediante un método ordinario que comprende mezclar al menos un compuesto de la presente invención con un portador adecuado sólido o líquido y, según se desee también con agentes auxiliares adecuados (por ejemplo, un tensioactivo, un disolvente y un estabilizante) para la mejora de la dispersabilidad del ingrediente activo y otras propiedades.

35

45

55

60

65

Los ejemplos de portadores y diluyentes sólidos incluyen sustancias vegetales (por ejemplo celulosa cristalina, almidón, pasta de madera, corcho, residuos del procesado de café, etc.), sustancias fibrosas, plástico artificial en polvo, arcilla (por ejemplo caolín, bentonita, arcilla blanca, tierra de diatomeas, óxido de silicio hidratado sintético, arcilla Fubasami, arcilla ácida, etc.), talco y materiales inorgánicos (por ejemplo vermiculita, montmorillonita, pumita, azufre en polvo, apatito, mica, sericita, cuarzo en polvo, carbón activo, carbonato de calcio, etc.), compuestos poliméricos (poli(cloruro de vinilo), resina de petróleo, etc.), y fertilizantes químicos (por ejemplo sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, cloruro de amonio, cloruro de calcio, urea, etc.). Los ejemplos de portadores y diluyentes líquidos incluyen agua, alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, ciclohexanol, etc.), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, etc.), éteres (por ejemplo etil cellosolve, butil cellosolve, dioxano, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, etil benceno, metil naftaleno, etc.), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo queroseno, parafina, etc.), ésteres (por ejemplo acetato de isopropilo, acetato de bencilo, etc.), nitrilos, amidas (por ejemplo N,N-dimetilformamida, dimetil sulfóxido, etc.), e hidrocarburos halogenados (por ejemplo clorobenceno, tricloroetileno, etc.).

50 Los ejemplos de portador gaseoso, concretamente un propulsor, incluyen dióxido de carbono, gas butano y fluorocarbono.

Los ejemplos de tensioactivo incluyen varios tensioactivos aniónicos y no iónicos, que se han utilizado habitualmente en el cambo de las sustancias agroquímicas. Los ejemplos de este tipo de tensioactivo aniónico incluyen tensioactivos de tipo sulfonato y sales de los mismos, tales como alquil sulfonato, α-olefinsulfonato, ligninosulfonato, alquilbenceno sulfonato, alquilnaftaleno sulfonato, un condensado de naftalenosulfonato con formalina, y dialquilsulfosuccinato; tensioactivos de tipo sulfato y sales de los mismos, tales como alquil éter sulfato polioxietilenado, estiril fenil éter polioxietilenado, fenil alquil alil éter sulfato polioxietilenado, glicolsulfato polioxietilenado, sulfato de alcohol superior, éster sulfato de ácido graso, y sulfato de fenil fenol (EO); tensioactivos de tipo fosfato y sales de los mismos, tales como alquil éter fosfato polioxietilenado, polioxietilenalquil alil fosfato, fosfato de fenil fenol (EO), fenil alquil alil éter fosfato polioxietilenado, fosfato de alcohol superior, y fosfato de tribencil fenol polioxietilenado; sales de ácido graso superior; y tensioactivos de tipo policarboxilato y sales de los mismos. Los ejemplos de las sales de los tensioactivos anteriormente descrito incluyen las sales de sodio, potasio, magnesio, calcio, amonio, etanolamina, dietanolamina, trietanolamina, y varias aminas. Los ejemplo de este tipo de tensioactivo no iónico incluyen alquil alil éter polioxietilenado, estiril fenil éter polioxietilenado, alquil éter polioxietilenado, fenil alquil alil éter polioxietilenado, éster de ácido graso de sorbitán polioxietilenado, glicol

polioxietilenado, alquil éster polioxietilenado, un copolímero en bloque de polioxietileno polioxipropileno, glicol polioxietilenado, alquino diol (acetilenglicol), alquinileno polioxietileno diol, éster de ácido graso de sorbitán, y un condensado de alquilaril éter de formalina.

- Los ejemplos de un estabilizante incluyen una mezcla de fosfato de isopropilo, fosfato de tricresilo, aceite de sebo, aceite de epoxi, tensioactivos, ácidos grasos y ésteres de los mismos. Además de los ingredientes anteriormente mencionados, el compuesto de la presente invención se puede procesar como agente farmacéutico por mezclado del mismo con otro fungicida, insecticida, herbicida, o fertilizante.
- En general, el agente farmacéutico anteriormente mencionado comprende de 1% a 95% en peso y, preferentemente de 1% a 50% en peso de al menos uno del compuesto [I] de la presente invención. Dicho agente farmacéutico se puede utilizar en solitario o diluido. Se pueden usar aproximadamente de 1 g a 5 kg/hectárea, y preferentemente aproximadamente de 2 g a 100 g/hectárea del compuesto [I] de la presente invención en una concentración en general de aproximadamente 1 a 50000 ppm, y preferentemente aproximadamente de 50 a 1000 ppm.

15

20

25

45

50

55

El compuesto representado por la fórmula general [I] de la presente invención se puede usar en solitario o en forma de un agente farmacéutico que comprende el mismo. De manera alternativa un agente farmacéutico, que consiste en una mezcla del presente compuesto con un microbicida, un fungicida, un agente antibiótico, un acaricida, un nematicida, un insecticida, un pesticida biótico, un herbicida, un agente de hormona vegetal, un modulador del crecimiento vegetal, un compuesto sinérgico, un atractor, un repelente, un pigmento, un fertilizante y similares, o una mezcla formada al combinar uno o dos o más compuestos seleccionados entre dichos ingredientes activos, que se puede usar como un agente de control de plagas. Se anticipa que, usando un agente de control de plagas de este tipo, se puede conseguir la expansión de la acción, enfermedades y plagas como dianas de control y periodo de aplicación y una reducción en la cantidad de fármaco, y un aumento en el efecto multiplicador, o bien se puede evitar el desarrollo de resistencias. En muchos casos, la actividad de una mezcla es superior a la actividad de un agente único y, de esta forma, se pueden lograr efectos cooperativos de los ingredientes combinados.

Los ejemplos de ingredientes combinados en una mezcla incluyen los siguientes compuestos y los similares.

30 Los ejemplos del fungicida incluyen azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, furconazol, hexaconazol, imibenconazol, metoconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, imazalil, triflumizol, pefurazoato, procloraz, fenarimol, fenhexamida, fenpropimorf, piperalina, espiroxamina, iprodiona, miclozolin, procimidona, vinclozolina, quinoxifen, fludioxonil, clorotalonil, ditianon, captano, folpet, iminoctadina-albesilato, iminoctadinatriacetato, ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metiram, propineb, policarbamato, tiram, ziram, zineb, óxido cúprico, 35 hidróxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre (anhídrido), sulfato de cobre, azufre, benomilo, carbendazim, dietofencarb, zoxamida, pencicuron, fluopicolida, furametpir, pentiopirad, tifluzamida, boscalid, oxicarboxina, carboxina, fluopiram, flutolanilo, mepronilo, azoxistrobin, picoxistrobin, cresoximmetil, trifloxistrobin, orisastrobin, metominostrobin, piraclostrobin, famoxadona, fenamidona, piribencarb, diflumetorim, ciazofamid, 40 amisulbrom, meptil dinocap, fluazinam, ferimzona, iprobenfos, isoprotiolano, quintozeno, propamocarb, proticarb, dimetomorf, iprovalicarb, bentiavalicarb, mandipropamid, piroquion, triciclazol, carpropamid, diclocimet, fenoxanil, balidamicina, polioxina B, acibenzolarS-metil, probenazol, isotianil, laminarina, cimoxanilo, fosetil-Al, triazíxodo, metasulfocarb, flusulfamida, etaboxam, ciflufenamid, metrafenona, ciprodinil, mepanipirim, pirimetanilo, blastcidin-S, estreptomicina, kasugamicina, metalaxilo, metalaxilo, oxadixilo, bupirimato, himexazol, y ácido oxolínico.

Los ejemplos del insecticida, acaricida y nematicida incluyen aldicarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, fenobcarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, tiodicarb, azefato, clorpirifos, diazinon, dimetoato, malatión, metamidofos, monocrotofos, paration-metil, profenofos, terbufos, endosulfan, etiprol, fipronil, bifentrin, cipermetrin, esfenvalerato, etofenprox, lambda-cihalotrina, teflutrina, DDT, metoxiclor, acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid, tiametoxam, Spinosyn, spinetoram, abamectin, emamectin-benzoato, milbemectin, kinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno, bromuro de metilo, cloropicrina, pimetrozina, flonicamid, clofentezina, hexitiazox, etoxazol, diafentiuron, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifon, clorfenapir, bensultap, cartap, tiociclam, clorfluazuron, diflubenzuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron, buprofezin, ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, amitraz, hidrametilnon, acequinocilo, fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, rotenona, indoxacarb, metaflumizona, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, fofuro de aluminio, clorantranilprol, flubendiamida, azadiractina, benzoximato, bifenazato, cinometionat, dicofol, y piridalilo.

Los ejemplos del herbicida incluyen bensulfuron-metil, azimsulfuron, cinosulfuron, ciclosulfamuron, pirazosulfuron-etil, imazosulfuron, indanofan, cihalofop-butil, tenilclor, esprocarb, etobenzanid, cafenstrol, clomeprop, dimetametrin, daimuron, bifenox, piributicarb, piriminobac-metil, pretilaclor, bromobutide, benzofenap, bentiocarb, bentoxazona, benfuresato, mefenacet, fenoxaprop-P-etil, fenmedifam, diclofop-metil, desmedifam, etofumesato, isoproturon, amidosulfuron, anilofos, benfuresato, etoxisulfuron, yodosulfuron, isoxadifen, foramsulfuron, piraclonil, mesosulfuron, diuron, neburon, dinoterb, carbetamida, bromoxinil, oxadiazon, dimefuron, diflufenican, aclonifen, benzofenap, oxaziclomefona, isoxaflutol, oxadiargil, flurtamona, metribuzin, metabenciazuron, tribufos, metamitron, etiozina,

# ES 2 443 154 T3

flufenacet, sulcotrion, fentrazamida, propoxicarbazona, flucarbazona, metosulam, amicarbazona, glifosate-isopropil amine, glifosate-trimesium, glufosinato-amonio, bialafos, butamifos, prosulfocarb, asulam, linuron, peróxido de calcio, alaclor, pendimetalin, acifluofen-sodio, lactofeno, ioxinil, alloxidim, setoxidim, napropamida, pirazolato, piraflufen-etil, imazapir, sulfentrazona, oxadiazon, paraquat, diquat, simazina, atrazina, flutiacetmetilo, quizalofop-etilo, bentazone, triaziflam, tidiazuron, mefenpir, etephon, y ciclanilida.

Los ejemplos de pesticidas bióticos incluyen el virus de la polihedrosis nuclear (NPV), virus de la granulosis (VG), virus de la polihedrosis citoplásmica (VPC), Steinernema carpocapsae, Steinernema glaseri, Monacrosporium phymatophagum, Steinernema kushidai, Pasteuria penetrans, Agrobacterium radiobacter, Bacillus subtilis, Erwinia carotovora, Pseudomonas fluorescens, Talaromyces flavus, Trichoderma atroviride, Bacillus thuringiensis, Beauveria brongniartii, Beauveria bassiana, Paecilomyces fumosoroseus, Verticillium lecanii, Xanthomonas campestris, Encarsia formosa, Eretmocerus eremicus, Eretmocerus mundus, Aphidius colemani, Aphidoletes aphidimyza, Diglyphus isaea, Dacnusa sibirica, Phytoseiulus persimilis, Amblyseius cucumeris, Amblyseius californicus, y Orius strigicollis.

Los ejemplos de agentes de feromonas incluyen Codlelure ((E,E)-8,10-Dodecadien-1-ol), Beetarmylure-B ((Z)-9Tetradecen-1-ol), acetato de tetradodecenilo (acetato de (Z)-11-Tetradecenilo), Pirimalure (14-Metil-1-octadeceno), y Peachflure ((Z)-13-Eicosen-10-ona).

20 Los ejemplos de fungicidas naturales e insecticidas naturales incluyen aceite para máquinas, acetato de metilfenilo, α-Pineno, hidrolizado de proteína, (Z)-1-Tetradecen-1-ol, y Turpentina.

### **Ejemplos**

10

15

30

35

40

A partir de ahora en el presente documento, la presente invención se va a describir específicamente mediante los siguientes ejemplos. Estos ejemplos no están previstos para limitar el alcance de la presente invención.

EJEMPLO 1 [Ejemplo de producción] (1) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = TMS (trimetilsililo), R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto n2 de la Tabla 1)

Etapa A: p-toluenosulfonato de 3-butinilo

10,00 g de 3-butin-1-ol y 40 ml de trietilamina se añadieron a 500 ml de diclorometano, y la disolución mezclada se enfrió a continuación hasta 0 °C. A continuación, se añadieron lentamente a la disolución 30,00 g de cloruro de paratoluenosulfonilo, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura ambiente durante toda la noche. A continuación, se añadió agua a la disolución de reacción, y a continuación se extrajo con 200 ml de diclorometano dos veces. La capa orgánica se lavó con 200 ml de agua dos veces, y a continuación se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; hexano : acetato de etilo = 6 : 1), para obtener 13,52 g de un compuesto de O-tosilo.

Etapa B: p-toluenosulfonato de 4-trimetilsilanil-3-butinilo

130 ml de tetrahidrofurano seco y 6,45 g del compuesto de O-tosilo obtenido en la etapa anteriormente descrita se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno, y la mezcla obtenida se enfrió a continuación hasta -78 °C. Tras finalizar el enfriamiento, se añadieron lentamente gota a gota a esta disolución 18,9 ml de una disolución de n-butil litio en hexano 1,6 M. Tras finalizar la adición gota a gota, la disolución obtenida se agitó a -78 °C durante 2 horas, y a continuación se añadieron lentamente gota a gota a la disolución de reacción 5,5 ml de cloruro de trimetilsililo. Tras finalizar la adición gota a gota, la disolución obtenida se agitó a -78 °C durante 15 minutos, y se agitó adicionalmente a temperatura ambiente durante 1 hora. Tras finalizar la agitación, se añadieron 150 ml de agua a la disolución de reacción, a continuación se extrajo con 150 ml de diclorometano dos veces, y a continuación se secó con sulfato de magnesio. La capa orgánica se concentró, y a continuación el residuo se secó a vacío, para obtener 8,37 g de un compuesto de trimetilsililo.

55 Etapa C: 2-(4-Trimetilsilanil-3-butinil)isoindol-1,3-diona

8,37 g del compuesto de trimetilsililo obtenido en la etapa anteriormente descrita, 7,85 g de ftalimida de potasio, y 0,46 g de yoduro de potasio se añadieron a 64 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 140 °C durante 2 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación se añadieron 100 ml de agua a la disolución de reacción, seguido por extracción con 100 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 100 ml de agua dos veces y a continuación con 100 ml de una disolución saturada de salmuera una vez, y se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. A continuación, el residuo se purificó mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 3,28 g de un compuesto de ftalimida.

65

# Etapa D: 4-Trimetilsilanil-3-butinilamina

10

15

121 ml de metanol y 2,25 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 3,28 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. A continuación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se suspendió en 50 ml de cloroformo, El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación. El concentrado se secó a presión reducida, para obtener 1,72 g de amina.

Etapa E: 4-(4-Trimetilsilanil-3-butinilamino)tieno[2,3-d]pirimidina

1,72 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 1,72 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 1,7 ml de trietilamina se añadieron a 32 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 80 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 50 ml de agua a lo anterior. La disolución mezclada se extrajo con 50 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 50 ml de agua dos veces y a continuación con 50 ml de una disolución saturada de salmuera una vez, y a continuación se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, la capa orgánica se concentró a continuación, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 1,83 g de un producto de interés.

- 20 Los compuestos con números 3 a 5 y 87 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.
  - (2) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 1 de la Tabla 1)
- 16 ml de tetrahidrofurano, 0,37 g de la 4-(4-trimetilsilanil-3-butinilamino)tieno[2,3-d]pirimidina obtenida en (1) anterior, y 2,1 ml de una disolución de fluoruro de tetrabutilamonio 1 M en tetrahidrofurano se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura ambiente durante 5 h. Tras finalizar la agitación, se añadieron 50 ml de una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio a la disolución de reacción, y la disolución así obtenida se extrajo a continuación con 30 ml de diclorometano dos veces. La capa orgánica se lavó con 30 ml de una disolución saturada de salmuera, y a continuación se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. A continuación, el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 0,20 g de 4-(3-butinilamino)tieno[2,3-d]pirimidina.
- 35 El compuesto con número 86 mostrado en la Tabla 1 se sintetizó con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.
  - (3) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = isobutilo, R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 7 de la Tabla 1)
- 40 Etapa A: 6-Metil-3-heptin-1-ol

22 ml de tetrahidrofurano seco y 25 ml de una disolución de bromuro de etil magnesio 1 M en tetrahidrofurano se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno, y a continuación, y a continuación se añadieron lentamente gota a gota a la disolución mezclada 2,9 ml de 4-metilpentino. La disolución obtenida se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, y a continuación, 25 ml de una disolución de óxido de etileno 1,1 M en tetrahidrofurano se añadieron lentamente gota a gota a la disolución de reacción a temperatura ambiente. La disolución obtenida se agitó adicionalmente a temperatura ambiente durante toda la noche. A continuación, se añadieron 100 ml de una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio a la disolución de reacción, y la disolución obtenida se extrajo a continuación con 100 ml de dietil éter dos veces. Se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El alcohol generado se utilizó directamente en la reacción posterior (rendimiento: 3,78 g).

Etapa B: 2-(6-Metil-3-heptinil)isoindol-1,3-diona

168 ml de tetrahidrofurano seco, 3,78 g del alcohol obtenido en la etapa anteriormente descrita, 4,06 g de ftalimida, y 7,21 g de trifenilfosfina se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno. A esta disolución se añadieron 13,9 ml de azodicarboxilato de dietilo (disolución en tolueno al 40 %) lentamente gota a gota a temperatura ambiente, y la disolución obtenida se agitó a temperatura ambiente durante 1 día, A continuación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación se añadieron 200 ml de agua al residuo. La disolución obtenida se extrajo con 150 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 200 ml de agua y a continuación con 200 ml de una disolución saturada de salmuera, y a continuación se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. A continuación, el residuo se purificó mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno), para obtener 5,08 g de un compuesto de ftalimida.

# Etapa C: 6-Metil-3-heptinilamina

200 ml de metanol y 3,73 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 5,08 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. A continuación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se lavó con 50 ml de cloroformo, y a continuación se suspendió en el cloroformo lavado. El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a presión reducida, para obtener 1,65 g de amina.

Etapa D: 4-(6-Metil-3-heptinilamino)tieno[2,3-d]pirimidina

10

15

- 1,65 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 2,13 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 1,9 ml de trietilamina se añadieron a 42 ml de DMF, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 85 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 100 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 100 ml de agua dos veces y a continuación con 100 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante y esta se secaron a continuación con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, la capa orgánica se concentró a continuación, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 2,14 g de un producto de interés.
- 20 Los compuestos con números 6, 8, 9, 88-91, y 94 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.
  - (4) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 10 de la Tabla 1)
- 25 Etapa A: 2-(4-Fenil-3-butinil)isoindol-1,3-diona

Bajo atmósfera de nitrógeno, 35 ml de tetrahidrofurano, 3,06 g de yodobenceno, y 9,0 ml de trietilamina se añadieron a 535 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 145 mg de yoduro de cobre, y 3,00 g de N-(3-butinil) ftalimida. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 4 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 3,70 g de un compuesto de ftalimida.

# Etapa B: 4-Fenil-3-butinilamina

35

40

135 ml de metanol y 2,52 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 3,70 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se suspendió en 50 ml de cloroformo, El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a presión reducida, para obtener 1,94 g de amina.

Etapa C: 4-(4-Fenil-3-butinilamino)tieno[2,3-d]pirimidina

1,94 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 1,90 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 1,9 ml de trietilamina se añadieron a 31 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 85 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, a continuación se añadieron 50 ml de agua a lo anterior, y la disolución obtenida se extrajo a continuación con 50 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 30 ml de agua dos veces y a continuación con 30 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 1,68 g de un producto de interés.

Los compuestos con números 11-28, 32-54, 64-67, 84, 85, 96-100, 102-126, 128, 130-209, 211-214, 306-342, y 355-380 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

55

(5) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = metilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 229 de la Tabla 1)

Etapa A: 2-(1-Metil-3-butinil)isoindol-1,3-diona

400 ml de tetrahidrofurano seco, 5,00 g de 4-pentin-2-ol, 9,65 g de ftalimida, y 17,13 g de trifenilfosfina se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno. A continuación, se añadieron lentamente a la disolución obtenida 30 ml de azodicarboxilato de dietilo (disolución en tolueno al 40 %) gota a gota a temperatura ambiente, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura ambiente durante 1 día. A continuación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación se añadieron 300 ml de agua al residuo, seguido por extracción con 250 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 200 ml de agua y a continuación con 200 ml de una disolución saturada de salmuera. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se

concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno), para obtener 2,20 g de un compuesto de ftalimida.

Etapa B: 2-(1-Metil-4-fenil-3-butinil)isoindol-1,3-diona

Bajo atmósfera de nitrógeno, 24 ml de tetrahidrofurano, 2,11 g de yodobenceno, y 6,2 ml de trietilamina se añadieron a 367 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 100 mg de yoduro de cobre, y 2,20 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 8 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 9 : 1), para obtener 1,82 g de un compuesto de ftalimida.

Etapa C: 1-Metil-4-fenil-3-butinilamina

5

10

20

25

30

63 ml de metanol y 1,18 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 1,82 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se suspendió en 30 ml de cloroformo, El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a presión reducida, para obtener la amina de manera cuantitativa.

Etapa D: 4-(1-Metil-4-fenil-3-butinilamino)tieno[2,3-d]pirimidina

La amina obtenida anteriormente, 1,02 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 0,9 ml de trietilamina se añadieron a 20 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 80 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 30 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 50 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 30 ml de agua dos veces y a continuación con 30 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 9 : 1), para obtener 0,46 g de un producto de interés.

Los compuestos con números 230-295, 298, 343-354, y 381-389 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

35 (6) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = 4-metoxicarbonilfenilo, R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 29 de la Tabla 1)

Bajo atmósfera de nitrógeno, 11 ml de tetrahidrofurano, 1,25 g de 4-yodobenzoato de metilo, y 2,9 ml de trietilamina se añadieron a 170 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 46 mg de yoduro de cobre, y 0,97 g de la 4-[(3-40 butinil)amino]tieno[2,3-d]pirimidina obtenida en (2) anterior. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 4 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 1 : 1), para obtener 1,09 g de benzoato de 4-[4-(tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilamino)-1-butinilo].

Los compuestos con números 30, 31, 92, 93, 95, 127, y 129 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

(7) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = 2-fenil-4-tiazolilo, R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 76 de la Tabla 1)

Etapa A: 4-Bromo-2-feniltiazol

Un matraz que contiene 238 mg de tetrakis(trifenilfosfina) paladio, 0,55 g de ácido fenilborónico y 1,00 g de 2,4-dibromotiazol se sometieron a sustitución con nitrógeno. A este matraz se añadieron 30 ml de tolueno, 6,1 ml de etanol, y 9,1 ml de una disolución acuosa de carbonato de sodio 2 M, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura de reflujo durante 6 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación se añadieron 50 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 50 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó con 30 ml de una disolución saturada de salmuera, y a continuación se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; hexano : acetato de etilo = 14 : 1), para obtener 0,71 g de 2-fenil-4-bromotiazol.

# Etapa B: 2-[4-(2-Feniltiazol-4-il)-3-butinil]isoindol-1,3-diona

Bajo atmósfera de nitrógeno, 15 ml de tetrahidrofurano, 1,50 g del 2-fenil-4-bromotiazol obtenido en la etapa anteriormente descrita, y 3,8 ml de trietilamina se añadieron a 221 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 60 mg de yoduro de cobre, y 1,24 g de N-(3-butinil) ftalimida. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 4 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 9 : 1), para obtener 1,24 g de un compuesto de ftalimida.

10 Etapa C: 4-(2-Feniltiazol-4-il)-3-butinilamina

15

40

45

60

35 ml de metanol y 0,65 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 1,24 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se suspendió en 20 ml de cloroformo, El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a presión reducida, para obtener 0,96 g de amina.

Etapa D: 4-[4-(2-Feniltiazol-4-il)-3-butinilamino]tieno[2,3-d]pirimidina

20 0,96 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 0,68 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 0,6 ml de trietilamina se añadieron a 13 ml de N,N-dimetil formamida. La mezcla obtenida se agitó a 85 °C durante 4 horas. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 25 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 30 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 30 ml de agua dos veces y a continuación con 30 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 2 : 1), para obtener 0,70 g de un producto de interés.

Los compuestos 77-82 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

(8) En la fórmula general (I),  $R^1$  = (2-bencil)-4-tiazolilo,  $R^2$  = H, y  $R^3$ - $R^4$  = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 75 de la Tabla 1)

35 Etapa A: 2-Bencil-4-bromotiazol

Un matraz que contenía 267 mg de tetrakis(trifenilfosfina) paladio y 1,00 g de 2,4-dibromotiazol se sometieron a sustitución con nitrógeno. A este matraz se añadieron 9 ml de tetrahidrofurano seco y 9,9 ml de una disolución de bromuro de bencil cinc 0,5 M en tetrahidrofurano. La mezcla obtenida se agitó a 70 °C durante 6 horas. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación se añadieron 30 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 30 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 30 ml de agua dos veces y a continuación con 30 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; hexano : acetato de etilo = 14 : 1), para obtener 0,36 g de 2-bencil-4-bromotiazol.

Etapa B: 2-[4-(2-Benciltiazol-4-il)-3-butinil]isoindol-1,3-diona

Bajo atmósfera de nitrógeno, 9 ml de tetrahidrofurano, 1,02 g del 2-bencil-4-bromotiazol obtenido en la etapa anteriormente descrita, y 2,3 ml de trietilamina se añadieron a 143 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 38 mg de yoduro de cobre, y 0,80 g de N-(3-butinil) ftalimida. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 4 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 9 : 1), para obtener 1,00 g de un compuesto de ftalimida.

Etapa C: 4-(2-Benciltiazol-4-il)-3-butinilamina

26 ml de metanol y 0,50 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 1,00 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se suspendió en 25 ml de cloroformo, El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a presión reducida, para obtener 0,12 g de amina.

Etapa D: 4-[4-(2-Benciltiazol-4-il)-3-butinilamino]tieno[2,3-d]pirimidina

0,12 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 0,08 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 0,1 ml de trietilamina se añadieron a 1,5 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 85 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 15 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 20 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 20 ml de agua dos veces y a continuación con 20 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 1 : 1), para obtener 0,07 g de un producto de interés.

(9) En la fórmula general (I),  $R^1$  = 2-fenoxi-4-tiazolilo,  $R^2$  = H, y  $R^3$ - $R^4$  = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 83 de la Tabla 1)

15 Etapa A: 4-Bromo-2-fenoxitiazol

10

20

25

30

40

60

3,00 g de 2,4-dibromotiazol, 1,74 g de fenol, y 3,44 g de carbonato de potasio se añadieron a 75 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 140 °C durante 6 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación se añadieron 100 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 100 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 100 ml de agua dos veces y a continuación con 50 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; hexano : acetato de etilo = 9 : 1), para obtener 2,86 g de un compuesto de éter.

Etapa B: 2-[4-(2-Fenoxitiazol-4-il)-3-butinil]isoindol-1,3-diona

Bajo atmósfera de nitrógeno, 26 ml de tetrahidrofurano, 2,86 g del compuesto de éter obtenido en la etapa anteriormente descrita, y 6,9 ml de trietilamina se añadieron a 399 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 109 mg de yoduro de cobre, y 2,24 g de N-(3-butinil) ftalimida. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 4 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 9 : 1), para obtener 3,50 g de un compuesto de ftalimida.

35 Etapa C: 4-(2-Fenoxitiazol-4-il)-3-butinilamina

90 ml de metanol y 1,76 g de hidrazina monohidrato (80 %) se añadieron a 3,50 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante toda la noche. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación el residuo se suspendió en 40 ml de cloroformo, El residuo insoluble se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a presión reducida, para obtener 2,24 g de amina.

Etapa D: 4-[4-(2-Fenoxitiazol-4-il)-3-butinilamino]tieno[2,3-d]pirimidina

2,24 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 1,45 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 1,3 ml de trietilamina se añadieron a 27 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 85 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 50 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 50 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 50 ml de agua dos veces y a continuación con 30 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 1 : 1), para obtener 2,79 g de un producto de interés.

Los compuestos 215-228 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

(10) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = 4-tiazolilo, R<sup>2</sup> = H, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = tiofeno (Síntesis del compuesto nº 61 de la Tabla 1)

Etapa A: 2-(4-Tiazolil-3-butinil)isoindol-1,3-diona

Bajo atmósfera de nitrógeno, 78 ml de tetrahidrofurano, 5,49 g de 4-dibromotiazol, y 20,3 ml de trietilamina se añadieron a 1184 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 322 mg de yoduro de cobre, y 6,64 g de N-(3-butinil) ftalimida. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 5 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 6,35 g de un compuesto de ftalimida.

### Etapa B: 4-Tiazolil-3-butinilamina

115 ml de etanol, 115 ml de agua, y 115 ml de una resina de intercambio iónico (Resina Diaion WA21J) se añadieron a 6,35 g del compuesto de ftalimida obtenido en la etapa anteriormente descrita, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 90 °C durante 2 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación la resina de intercambio iónico se filtró.

La disolución de reacción se concentró a presión reducida, para obtener 2,48 g de amina.

10 Etapa C: 4-[(4-Tiazolil-3-butinil)amino]tieno[2,3-d]pirimidina

2,48 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 2,60 g de 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, y 2,3 ml de trietilamina se añadieron a 50 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 85 °C durante 2,5 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadió a lo anterior 1 l de agua. El sólido precipitado se filtró, y el filtrado se lavó a continuación con 100 ml de agua dos veces, seguido por secado a vacío, para obtener 3,00 g de un producto de interés.

Los compuestos con números 55-60, 62, 63, 68-74, 101, y 210 mostrados en la Tabla 1 se sintetizaron con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

(11) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = fenilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = benceno (Síntesis del compuesto nº 300 de la Tabla 1)

Etapa A: 1-Fenil-3-butinilamina

15

20

50

- Bajo atmósfera de nitrógeno, una disolución 1 M de bistrimetilsililamida de litio-tetrahidrofurano se añadió gota a gota a 0 °C a una disolución preparada añadiendo 2,97 g de benzaldehído a 4 ml de tetrahidrofurano. La disolución obtenida se agitó a 0 °C durante 15 minutos y a continuación a temperatura ambiente durante 1 hora. Esta disolución se define como la disolución A.
- 30 Bajo atmósfera de nitrógeno, se añadieron 4 ml de tetrahidrofurano y 0,63 g de 1,2-dibromoetano a 6,03 g de polvo de cinc, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura de reflujo durante 1 h. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente. A continuación, una disolución en tetrahidrofurano de clorotrimetil silano (0,37 g de clorotrimetilsilano + 8 ml de tetrahidrofurano) se añadió a la disolución de reacción a temperatura ambiente. La disolución obtenida se enfrió a -10 °C, y a continuación se añadió gota a gota al o anterior 35 una disolución en tetrahidrofurano de bromuro de propargilo (10,00 g de bromuro de propargilo + 8 ml de tetrahidrofurano). La mezcla obtenida se agitó adicionalmente a -10 °C durante 1,5 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución A se añadió gota a gota a esta disolución a -10 °C. Tras finalizar la adición gota a gota, la temperatura de la disolución de reacción aumentó gradualmente a temperatura ambiente, y la disolución se agitó a continuación a temperatura ambiente durante toda la noche. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a 0 °C, y a 40 continuación se añadieron a lo anterior 20 ml de una disolución saturada de carbonato de potasio. A continuación, se añadieron a lo anterior 65 ml de agua y 30 ml de metil t-butil éter. La capa orgánica se sometió a separación de líquidos, y la capa acuosa se extrajo adicionalmente con 30 ml de metil t-butil éter cinco veces. Las capas orgánicas reunidas se concentraron, y a continuación el residuo se secó a vacío. Se añadió agua a este residuo, y la disolución obtenida se extrajo a continuación con 30 ml de metil t-butil éter dos veces. La capa orgánica se lavó 30 ml de agua 45 dos veces y a continuación con 30 ml de una disolución saturada de salmuera. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y el filtrado se concentró a continuación, seguido por secado a vacío. para obtener 3,38 g de amina.

Etapa B: 4-[(1-Fenil-3-butinil)amino]quinazolina

0,49 g del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 0,50 g de 4-cloroquinazolina, y 0,7 ml de trietilamina se añadieron a 11 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 85 °C durante 3 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 50 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 20 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó 20 ml de agua dos veces y a continuación con 20 ml de una disolución saturada de salmuera una vez. La resultante se secó con sulfato de magnesio. El sulfato de magnesio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel. C-200; tolueno : acetato de etilo = 1 : 1), para obtener 0,69 g de un producto de interés.

60 (12) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = fenilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = benceno (Síntesis del compuesto nº 301 de la Tabla 1)

Bajo atmósfera de nitrógeno, 17 ml de tetrahidrofurano, 1,49 g de yodobenceno, y 4,5 ml de trietilamina se añadieron a 278 mg de 32 ml de diclorobis(trifenilfosfina) paladio, 71 mg de yoduro de cobre, y 2,00 g de la 4-[(1-fenil-3-butinil)amino]quinazolina obtenida en (11) anterior. La mezcla obtenida se agitó a temperatura de reflujo durante 3 horas. Tras finalizar la agitación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y el sólido se filtró a

continuación. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía en columna (Wako Gel C-200; tolueno : acetato de etilo = 4 : 1), para obtener 1,03 g de 4-[(1,4-difenil-3-butinil)amino]quinazolina. El compuesto con número 302 mostrado en la Tabla 1 se sintetizó con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

5

(13) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = etoxicarbonilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = benceno (Síntesis del compuesto nº 303 de la Tabla 1)

Etapa A: N-(difenilmetilo)-2-(3-fenil)propargil glicina etilo

10

15

50 ml de acetonitrilo, 3,00 g de N-(difenilmetilen)glicina etilo, 2,60 g de bromuro de 3-fenilpropargilo, 2,32 g de carbonato de potasio, y 381 mg de hidrogenosulfato de tetrabutilamonio se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno. La mezcla obtenida se agitó a 70 °C durante 24 horas. A continuación, la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación se añadieron 100 ml de acetato de etilo a lo anterior, seguido por filtración en Celite. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera<sup>™</sup>), N-(difenilmetilo)-2-(3-fenil)propargil glicina etilo

Etapa B: 2-(3-Fenil)propargil glicina etilo

20 20 ml de dietil cinc, 1,80 g del alcohol obtenido en la etapa anteriormente descrita, y 20 ml de ácido clorhídrico 1 N se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura ambiente durante 1 día. A continuación, se añadieron 30 ml de bicarbonato de sodio de sodio en agua a la disolución de reacción, y la disolución obtenida se extrajo con 50 ml de acetato de etilo dos veces y a continuación se secó con sulfato de sodio. El sulfato de sodio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera ™), para obtener 985 mg de 2-(3-25 fenil)propargil glicina etilo. Etapa C: 4-[2-Etoxicarbonil-4-fenil-3-butinilamino]quinazolina

30

985 mg del compuesto de amina obtenido en la etapa anteriormente descrita, 720 mg de 4-cloroquinazolina, y 1 ml de trietilamina se añadieron a 15 ml de N,N-dimetil formamida, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 80 °C durante 4 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 40 ml de agua a lo anterior, seguido por extracción con 70 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó con 40 ml de una disolución saturada de salmuera dos veces, y a continuación se secó con sulfato de sodio. El sulfato de sodio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera <sup>™</sup>), para obtener 1,10 g de un producto de interés.

35

El compuesto con número 304 mostrado en la Tabla 1 se sintetizó con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

(14) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = hidroximetilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = benceno (Síntesis del compuesto nº 299 de la

40

45

200 mg de 4-[2-etoxicarbonil-4-fenil-3-butinilamino]quinazolina y 1 ml de una disolución 1 M de borohidruro de dimetilamino litio en tetrahidrofurano se añadieron a 10 ml de tetrahidrofurano, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a temperatura ambiente durante 1 h. A continuación, se añadieron 20 ml de ácido clorhídrico 1 N a la disolución de reacción, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante 10 minutos. A continuación, se añadió bicarbonato de sodio de sodio en aqua a la disolución de reacción para su neutralización. La disolución obtenida se extrajo con 40 ml de acetato de etilo dos veces, y a continuación se secó con sulfato de sodio. El sulfato de sodio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó a continuación mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera<sup>™</sup>), para obtener 37 mg de 4-[2-hidroximetil-4-fenil-3butinilamino]quinazolina.

50

(15) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = metilaminocarbonilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = benceno (Síntesis del compuesto nº 305 de la Tabla 1)

55 130 mg de 4-[2-etoxicarbonil-4-fenil-3-butinilamino]quinazolina y 3 ml de una disolución al 40 % de metilamina en metanol se añadieron a 5 ml de tetrahidrofurano, y la mezcla obtenida se agitó a 60 °C durante 1 h, y a continuación a temperatura ambiente durante un día y una noche. A continuación, la disolución de reacción se concentró, y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera™), para obtener 113 mg de 4-[2-metilaminocarbonil-4-fenil-3-butinilamino]quinazolina.

60

(16) En la fórmula general (I), R<sup>1</sup> = fenilo, R<sup>2</sup> = vinilo, y R<sup>3</sup>-R<sup>4</sup> = benceno (Síntesis del compuesto nº 296 de la Tabla

65

Etapa A: 2-Vinil-4-fenil-3-butinol

40 ml de tetrahidrofurano seco y 20 ml de una disolución de n-butil litio 1,6 M en tetrahidrofurano se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno a -78 °C, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante 30 minutos. A continuación, y a continuación se añadieron lentamente gota a gota a la disolución de reacción 3,5 ml de complejo de trifluoroborano tetrahidrofurano. La disolución obtenida se agitó adicionalmente a -78 °C durante 15 minutos, y se añadieron lentamente gota a gota a lo anterior 2,00 g de monoepóxido de 1,3-butadieno. La mezcla así obtenida se agitó adicionalmente a -78 °C durante 3 horas. A continuación, se añadieron 50 ml de una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio a la disolución de reacción, y la disolución obtenida se extrajo con 100 ml de acetato de etilo una vez y a continuación se secó con sulfato de sodio. El sulfato de sodio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera<sup>™</sup>), para obtener 1,80 g de 2-vinil-4-fenil-3-butinol.

# Etapa B: 2-(2-Vinil-4-fenil-3-butinil)isoindol-1,3-diona

55 ml de tolueno, 1,80 g de 2-vinil-4-fenil-3-butinol, 1,93 g de ftalimida, y 3,45 g de trifenilfosfina se añadieron a un matraz con atmósfera de nitrógeno. A continuación, se añadieron lentamente a la disolución anteriormente obtenida 5,30 g de azodicarboxilato de dietilo (disolución en tolueno al 40 %) gota a gota a temperatura ambiente con enfriamiento mediante hielo. La temperatura aumentó hasta temperatura ambiente, y la mezcla obtenida se agitó a continuación durante 1 día. A continuación, la disolución de reacción se concentró, y a continuación se añadieron 200 ml de dietil éter al residuo. El sólido que apareció se eliminó por filtración. El residuo se concentró, y se purificó a continuación mediante cromatografía instantánea (fabricada por Biotage AB; Isolera<sup>™</sup>), para obtener 1,00 g de 2-(2-vinil-4-fenil-3-butinil)isoindol-1,3-diona.

#### Etapa C: 2-Vinil-4-fenil-3-butinilamina

20 ml de metanol y 10 ml de una disolución de metilamina (disolución al 40 % en metanol) se añadieron a 1,00 g de 25 2-(2-vinil-4-fenil-3-butinil)isoindol-1,3-diona, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 60 °C durante 1 h. A continuación, la disolución de reacción se concentró, y se lavó sucesivamente con 50 ml de acetato de etilo y 50 ml de dietil éter. A continuación, el filtrado se concentró, para obtener 550 mg de amina como un compuesto bruto.

#### 30 Etapa D: 4-[2-Vinil-4-fenil-3-butinilamino]quinazolina

550 mg de 2-vinil-4-fenil-3-butinilamina, 500 mg de 4-cloroquinazolina, y 636 ml de trietilamina se añadieron a 15 ml de DMF, y la mezcla obtenida se agitó a continuación a 80 °C durante 5 h. A continuación, la disolución de reacción se enfrió, y a continuación se añadieron 20 ml de aqua a lo anterior, seguido por extracción con 50 ml de acetato de etilo dos veces. La capa orgánica se lavó con 50 ml de una disolución saturada de salmuera dos veces, y a continuación se secó con sulfato de sodio. El sulfato de sodio se filtró, y la capa orgánica se concentró a continuación. El residuo se purificó mediante un equipo de cromatografía instantánea automatizado (fabricado por Biotage AB; Isolera ), para obtener 750 mg de un producto de interés.

40 El compuesto con número 297 mostrado en la Tabla 1 se sintetizó con el mismo método de producción que el descrito anteriormente.

Debe indicarse que los productos comerciales utilizaron fueron 4-clorotieno[2,3-d]pirimidina, 4-clorotieno[3,2d]pirimidina, 4-cloro-7-metiltieno[3,2-d]pirimidina, 4-cloroquinazolina, 4,6-dicloro-5-metilpirimidina, 6-cloropurina, 6cloro-7-deazapurina, 4,6-dicloropirimidina, 4-cloro-6-metilpirimidina y 4,6-dicloro-5-nitropirimidina, y que 4,6-dicloro-5fenilpirimidina, 4,5-dicloro-6-(1-fluoroetil)pirimidina y 4-cloro-5-yodo-6-(1-fluoroetil)pirimidina se produjeron de acuerdo con los métodos descritos en el documento W02006/138734, en la patente japonesa abierta a consulta nº 2000-7662 y en la patente japonesa abierta a consulta nº 2002-275164, respectivamente.

50 Los compuestos [I] sintetizados de esta manera y sus propiedades físicas se muestran en la Tabla 1 (de la Tabla 1-1 a la Tabla 1-71). Además, los datos de RMN de los compuestos [I] se muestran en la Tabla 2 (de la Tabla 2-1 a la Tabla 2-25). Debe indicarse que, en la presente memoria descriptiva, el término "Tabla 1" se utiliza como un nombre genérico (nombre comprehensivo) de la Tabla 1-1 a la Tabla 1-71, y que el término "Tabla 2" se utiliza como un nombre genérico (nombre comprehensivo) de la Tabla 2-1 a la Tabla 2-25.

	[Tabla 1-1	]
mpuesto nº	Estructura	

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
1	H Z Z Z	p.f. 117 ~ 119°C

10

15

20

35

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
2	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 144 ~ 146°C
3	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 152 ~ 154°C
4	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 196 ~ 198°C
5	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 190 ~ 192°C
6	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	p.f. 66 ~ 68°C

[Tabla 1-2]

Camanicanta no	[Tabla 1-2]	Draniadad física
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
7	HN N	p.f. 94 ~ 95°C
8	HNNN	p.f. 146 ~ 147°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
9	HN Z S	p.f. 90 ~ 92°C
10	HN	p.f. 129 ~ 132°C
	s l	
11	HN	p.f. 141 ~ 144°C
	s N	
12	HN	p.f. 118 ~ 122°C
	S N	

[Tabla 1-3]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
13	F HN Z S	p.f. 147 ~ 149°C
14		p.f. 145 ~ 147°C
15		p.f. 131 ~ 135°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
16	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 130 ~ 132°C
17	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto oleoso
18	H Z Z Z	p.f. 120 ~ 123°C

Tabla 1-4]

Compuesto nº Estructura

Propiedad física

p.f. 125 ~ 127°C

Producto resinoide

Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
22	OMe	p.f. 141 ~ 143°C
23	HN N S N N	Producto resinoide
24	OMe OMe	p.f. 182 ~ 184°C

[Tabla 1-5]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
25	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 116 ~ 117°C
26	CF <sub>3</sub>	p.f. 123 ~ 125°C
27	CF <sub>3</sub>	p.f. 129 ~ 134°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
28	CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>	p.f. 163 ~ 166°C
29	HN CO <sub>2</sub> Me	p.f. 113 ~ 114°C
30	CO <sub>2</sub> Me	p.f. 163 ~ 166°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
34	HN N S N	p.f. 96 ~ 99°C
35	HN CN	p.f. 197 ~ 198°C
36	HN Z	p.f. 187 ~ 188°C

[Tabla 1-7]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
37	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 173 ~ 174°C
38	HN NO <sub>2</sub>	p.f. 162 ~ 163°C
39	HN Z S	p.f. 171 ~ 172°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
40	HN NO <sub>2</sub>	p.f. 184 ~ 185°C
41	HN Z S	p.f. 177 ~ 178°C
42		p.f. 179 ~ 181°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
46	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto oleoso
47	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto oleoso

[Tabla 1-9]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
48	HN CHO	p.f. 162 ~ 163°C
49	HN OMe	Producto oleoso
50	HN OMe	Producto oleoso
51	HN OMe	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
52	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 117 ~ 118°C
53	HN N S	p.f. 127 ~ 128°C

[Tabla 1-10]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
54	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 153 ~ 155°C
55	HN Z N	p.f. 178 ~ 180°C
56		p.f. 138 ~ 140°C
57	THE ZES	p.f. 140 ~ 141°C
58	HN N N	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
59	HN Z Z Z	p.f. 112 ~ 113°C

г	Га	h	_	4	4	1	11
	ıa	U	ıa	- 1	-		

Compuesto nº	[Tabla 1-11] Estructura	Propiedad física
		-1
60	OMe N N OMe	Producto resinoide
61	HN N S	p.f. 156 ~ 158°C
62	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 128 ~ 129°C
63	HN Z N	p.f. 174°C
64	Br N N N N N N	p.f. 90 ~ 92°C

[Tabla 1-12]

[Tabla 1-12]				
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física		
65	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 148 ~ 150°C		
66	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 160 ~ 161°C		
67	OMe N S N	p.f. 152 ~ 153°C		
68	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto resinoide		
69	CHO N=S N	Producto resinoide		

[Tabla 1-13]

	[Tabla 1-13]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
70	HN N S	p.f. 193°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
71	HN N S N	Producto resinoide
72	OMe N S N	Producto resinoide
73	OCOMe N S N	p.f. 128 ~ 129°C
74	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto oleoso

	[Tabla 1-14]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
75	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
76	HN Z S	p.f. 134 ~ 136°C
77	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 53 ~ 55°C
78	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 140 ~ 142°C

[Tabla 1-15]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
79	HN Z N	Producto resinoide
80		p.f. 55 ~ 56°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
81	HN Z S	p.f. 175 ~ 177°C
82	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 79 ~ 80°C
83	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto resinoide

[Tabla 1-16]

	[1abla 1-16]	<b>I</b>
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
84	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 193 ~ 195°C
85	OMe N N N	Producto resinoide
86	HN N	p.f. 160 ~ 162°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
87	HN N	p.f. 159 ~ 161°C
88	HN n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	p.f. 99 ~ 101°C
89	n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	p.f. 82 ~ 84°C

[Tabla 1-17]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
91	HNNN	p.f. 155 ~ 157°C
92	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 139°C
93	HN CN	p.f. 84 ~ 86°C
94	HN N N	p.f. 160 ~ 162°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
95	HN N	Producto oleoso

[Tabla	1-1	8
--------	-----	---

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
96	HNNN	p.f. 120 ~ 122°C
97	HN CI	Producto resinoide
98	HN N	p.f. 183 ~ 184°C
99	HN Z=	Producto oleoso
100	HN CHF <sub>2</sub>	Producto oleoso
101	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 136 ~ 138°C

[Tabla 1-19]

[Tabla 1-19]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
102	HN CN	p.f. 150 ~ 151°C
103		p.f. 106 ~ 107°C
104	HZ Z Z	p.f. 90 ~ 91°C
105	HZ Z	p.f. 92 ~ 94°C
106	HN N	p.f. 102 ~ 105°C
107	HN N	p.f. 100 ~ 102°C

[Tabla 1-20]

[Tabla 1-20]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
108	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Producto resinoide
109	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 152 ~ 154°C
110	HZ Z Z	Producto resinoide
111	H Z Z Z	Producto resinoide
112	HN N	p.f. 144 ~ 146°C

[Tabla 1-21]			
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física	
113	HN N	Producto oleoso	

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
114		p.f. 141 ~ 142°C
115	HN OMe	Producto oleoso
116	SMe	p.f. 141 ~ 142°C
117	HN N	p.f. 147 ~ 148°C
118	HN N N	p.f. 119 ~ 120°C

[Tabla 1-22]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
119	HN	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
120	HN N	p.f. 164 ~ 165°C
121	O OMe	p.f. 108 ~ 110°C
122	HN N	p.f. 175 ~ 176°C
123	HN Z Z	Producto oleoso

[Tabla 1-23]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
124	HN N	Producto oleoso
125	HN MeO N O	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
126	HZ Z Z	p.f. 212 ~ 214°C
127	HN CO <sub>2</sub> H	Producto resinoide
128	COMe	Producto resinoide

[Tabla 1-24]		
No	Estructura	Propiedad física
129	HN CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	p.f. 137 ~ 138°C
130	HN OH	p.f. 156 ~ 157°C
131	HN N	p.f. 113 ~ 115°C

No	Estructura	Propiedad física
132	HN N	p.f. 69 ~ 71°C
133	HN OMe	p.f. 108 ~ 110°C

[Tabla 1-25]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
134	HN OCHF2	Producto resinoide
135	HN OMe	Producto resinoide
136	OMe	p.f. 107 - 109°C
137	HN *OMe	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
138	HN HO CF <sub>3</sub>	p.f. 183 ~187°C

[Tabla 1-26]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
139	HN OMe	p.f. 121 ~ 122°C
140	HN OMe	p.f. 122 ~ 124°C
141	HN OMe	Producto oleoso
142	HN N OMe	p.f. 124 ~ 125°C
143	HN OMe	Producto oleoso

[Tabla 1-27]

[Tabla 1-27]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
144	HN OMe	Producto oleoso
145	HN OMe	p.f. 102 ~ 105°C
146	HN OMe	p.f. 121 ~ 125°C
147	HN Z CN	p.f. 146 ~ 147°C
148	HN O OMe	Producto oleoso

[Tabla 1-28]

	[Tabla T 20]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
149	HN MeO OMe	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
150	HN N	Producto oleoso
151	HN Z	p.f. 143 ~ 144°C
152	HN SMe	p.f. 131 ~ 133°C
153	HNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNN	Producto oleoso

[Tabla 1-29]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
154	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto resinoide
155	H N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
156	HN N	p.f. 163 ~ 165°C
157	HN N	Producto resinoide
158	HN N OH	Producto resinoide

[Tabla 1-30]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
159	H Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	Producto resinoide
160		p.f. 177 ~ 178°C
161	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 146 ~ 148°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
162	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto resinoide
163	T Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	p.f. 176 ~ 177°C

[Tabla 1-31]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
164	HN F	p.f. 198 ~ 199°C
165	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 163 ~ 164°C
166	HN N	p.f. 161 ~ 162°C
167	F Z Z Z	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
168	HN Z CF3	p.f. 147 ~ 148°C

[Tabla 1-32]

Compuesto nº	[Tabla 1-32] Estructura	Propiedad física
169	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 134 ~ 135°C
170	HN CN	p.f. 142 ~ 143°C
171	HN CI	p.f. 175 ~ 176°C
172	HN CI	p.f. 182 ~ 183°C
173	HN CI	p.f. 176 ~ 177°C

[Tabla 1-33]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
174	CI C	p.f. 153 ~ 155°C
175	HN N	p.f. 147 ~ 148°C
176	CF <sub>3</sub>	p.f. 144 ~ 145°C
177	CF <sub>3</sub>	p.f. 139 ~ 140°C
178	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 161 ~ 163°C

[Tabla 1-34]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
179	HNZ	CI OMe p.f. 147 ~ 149°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
180	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 153 ~ 155°C
181	HNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNNN	Producto oleoso
182	HN CI	p.f. 135 ~ 139°C
183	HN N	p.f. 159 ~ 160°C
184	OMe OMe	p.f. 191 ~ 192°C

Tabla 1-35]

14514 1 00]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
185	OMe HN N	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
186	HN N	Producto oleoso
187	HN CN	p.f. 181 ~ 182°C
188	HN N	Producto resinoide
189		Producto resinoide
190	HN	p.f. 183 ~ 186°C

[Tabla 1-36]			
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física	
191	HNNN	Producto resinoide	

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
192	HN N	Producto resinoide
193	r\_z	p.f. 145 ~ 150°C
194	F Z Z	p.f. 157 ~ 158°C
195	H C C	p.f. 168 ~ 170°C

[Tabla 1-37]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
196	HN Z	Producto resinoide
197	HN N	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
198	LN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 134 ~ 139°C
199	OMe N N N	p.f. 161 ~ 163°C
200	THE ZEE ZEE ZEE ZEE ZEE ZEE ZEE ZEE ZEE Z	Producto resinoide
201	DH NO DH	p.f. 182 ~ 186°C

[Tabla 1-38]

[Tabla 1-38]			
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física	
202	Z Z	OH p.f. 183 ~ 185°C	
203	HN N	Producto oleoso	

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
204	HN Z Z	p.f. 160 ~ 161°C
205	HN N	p.f. 180 ~ 181°C
206	HN Z	p.f. 141 ~ 142°C
207	HN MeO	Producto resinoide

[Tabla 1-39]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
208	HN N N	p.f. 141 ~ 143°C
209	HN. N	p.f. 135 ~ 147°C
210	Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	p.f. 204 ~ 207°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
211	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 159 ~ 160°C
212	OMe N S	p.f. 145 ~ 146°C

[Tabla 1-40]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
213	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	p.f. 113 ~ 114°C
214	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	p.f. 139 ~ 140°C
215	MeO N S N S	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
216	OMe N S	p.f. 77 ~ 79°C
217	O——OMe	p.f. 150 ~ 152°C

[Tabla 1-41] Compuesto nº Estructura Propiedad física 218 p.f. 159 ~ 161 °C 219 p.f. 106 ~ 108°C p.f. 137 ~ 139°C 220 p.f. 185 ~ 186°C 221

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
222	CN N S N S	p.f. 137 ~ 139°C

[Tabla 1-42]

Compuesto nº	[Tabla 1-42] Estructura	Propiedad física
223	O CN	p.f. 55 ~ 57°C
224	HN Z J	p.f. 136 ~ 138°C
225	F Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	p.f. 134 ~ 136°C
226	HN Z = N	p.f. 116 ~ 118°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
227	HN Z	Producto resinoide

[Tabla 1-43]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
228		Producto oleoso
229	HN racémico	Producto resinoide
230	HN racémico	p.f. 126 ~128°C
231	HN * CI	Producto oleoso
232	HN racémico	p.f. 110 ~ 115°C

ГΤа	hla	1-	441
па	via.	- 1-	-441

[Tabla 1-44]  Compuesto nº Estructura Propiedad física			
Compueston	Estructura	Propiedad fisica	
233	HN * CF <sub>3</sub>	Producto oleoso	
234	CF <sub>3</sub>	Producto oleoso	
235	HN racémico	p.f. 126 ~ 129°C	
236	HN OMe  racémico	Producto resinoide	
237	HN SO <sub>2</sub> Me	Producto oleoso	
238	SF <sub>5</sub> N racémico	p.f. 129 ~ 132°C	

[Tabla 1-45]

Compuesto nº	[Tabla 1-45] Estructura	Propiedad física
239	HN * racémico	Producto oleoso
240	HN * racémico	Producto oleoso
241	HN racémico	Producto oleoso
242	HN racémico	Producto oleoso
243	HN OH racémico	p.f. 141 ~ 142°C
244	HN OH OH	p.f. 138 ~ 139°C

[Tabla	1-46]
--------	-------

[Tabla 1-46]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
245	HN + OH racémico	p.f. 125 ~ 126°C
246	HN racémico	Producto resinoide
247	HN * CI  N racémico	Producto resinoide
248	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 118 ~ 120°C
249	HN * CF <sub>3</sub>	Producto oleoso

[Tabla 1-47]

Compuesto nº	Estructura	•	Propiedad física
250	H Z Z Z	racémico	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
251	HN • CI  N racémico	Producto oleoso
252	CI CF <sub>3</sub> N racémico	Producto resinoide
253	SF <sub>5</sub> N racémico	Producto oleoso
254	HN + CF <sub>3</sub>	Producto resinoide
255	HN CI N racémico	Producto oleoso

[Tabla 1-48]

	[1454 1 16]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
256	HN * CI SO <sub>2</sub> Me	p.f. 129 ~ 134°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
257	HN * CI CF <sub>3</sub>	p.f. 119 ~ 123°C
258	HN * CF <sub>3</sub>	p.f. 115 ~ 117°C
259	HN * racémico	Producto oleoso
260	HN * CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
261	CI F  HN * racémico	Producto resinoide

[Tabla 1-49]

[1606 1-49]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
262	CI CF <sub>3</sub> HN racémico	Producto oleoso

## ES 2 443 154 T3

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
263	HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
264	HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
265	HN + racémico	Producto resinoide
266	HN racémico	Producto resinoide
267	HN racémico	Producto oleoso

Compuesto nº Estructura Propiedad física

268 Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
269	HN racémico	Producto oleoso
270	HN. racémico	p.f. 158 ~ 160°C
271	HN racémico	p.f. 154 ~ 157°C
272	HN * CI	p.f. 158 ~ 159°C
273	HN racémico	Producto resinoide

[Tabla 1-51]

	[18018 1-31]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
		•
274	HN * CF <sub>3</sub>	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
275	HN * racémico	p.f. 138 ~ 141°C
276	HN * OMe	Producto oleoso
277	SF <sub>5</sub>	Producto oleoso
278	HN * OMe	Producto oleoso
279	HN * racémico	p.f. 164 ~ 166°C

[Tabla 1-52]

	[1 abla 1-52]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
280	HN CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub> racémico	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
281	F <sub>3</sub> C F CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
282	HN CI CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
283	HN CI SF <sub>5</sub>	Producto oleoso
284	CI CF <sub>3</sub>	Producto resinoide

[Tabla 1-53]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
285	HN * CF <sub>3</sub>	p.f. 130 ~ 131 °C
286	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 104 ~ 105°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
287	HN CF <sub>3</sub> N racémico	p.f. 121 ~ 124°C
288	HN * racémico	p.f. 110 ~ 112°C
289	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 130 ~ 131 °C

[Tabla 1-54]

	[Tabla 1-54]	<b>b</b>
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
290	HN + O=S=O	Producto oleoso
291	HN racémico	p.f. 142 ~ 145°C
292	N racémico	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
293	HN racémico	Producto resinoide
294	HN + racémico	Producto oleoso

[Tabla 1-55] Compuesto nº Estructura Propiedad física 295 Producto oleoso racémico 296 Producto oleoso racémico 297 Producto oleoso racémico 298 Producto oleoso racémico

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
299	OH N racémico	Producto oleoso
300	HN racémico	p.f. 127 ~ 129°C

[Tabla 1-56]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
301	HN * racémico	p.f. 141 ~ 143°C
302	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 150 ~ 152°C
303	O O HN racémico	Producto oleoso
304	N racémico	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
305	O NH HN * racémico	Producto resinoide

[Tabla 1-57]

[Tabla 1-57]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
306	HN CF3	p.f. 118 ~ 124°C
307	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 170 ~ 171°C
308	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 153 ~ 154°C
309	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 145 ~ 146°C
310	CI HN CF3	p.f. 95 ~ 97°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
311	HN N OMe	159°C

[Tabla 1-58]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
312	HN OMe	p.f. 118 ~ 120°C
313	CI NOME	Producto resinoide
314	CI HN OMe	Producto oleoso
315	HN OMe	p.f. 143 ~ 144°C
316	HN OMe	p.f. 113 ~ 115°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
317	HN OMe	p.f. 121 ~ 122°C

[Tabla 1-59]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
318	F HN OMe	Producto resinoide
319	HN OMe	p.f. 117 ~ 119°C
320	HN OME	p.f. 111 ~ 114°C
321	Br OMe	p.f. 118 ~ 120°C
322	HN OMe	p.f. 121 ~ 123°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
323	HN OMe	Producto oleoso

[Tabla 1-60]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
324	HN OMe	p.f. 77 ~ 79°C
325	HN OMe	Producto resinoide
326	HN OMe	Producto oleoso
327	HN OMe	Producto oleoso
328	HN OMe	Producto resinoide

329	Me O O Me	Producto oleoso
-----	-----------	-----------------

[Tabla 1-61]

[Tabla 1-61]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
330	NC NO OME	Producto oleoso
331	O <sub>2</sub> N OMe	Producto oleoso
332	HN OMe	Producto oleoso
333	HN N OMe	Producto resinoide
334	HN OMe	Producto resinoide
335	HN OMe	Producto resinoide

[Tabla 1-62]

[Tabla 1-62]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
336	HN OMe	p.f. 168 ~ 170°C
337	HN OMe	Producto resinoide
338	HN OMe	p.f. 161 ~ 162°C
339	HN N OMe	Producto oleoso
340	HN OMe	Producto oleoso
341	HN OMe	Producto oleoso

[Tabla 1-63]

Compuesto nº	[Tabla 1-63] Estructura	Propiedad física
342	HN CF <sub>3</sub>	>240°C
343	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 105 ~ 108°C
344	HN CF <sub>3</sub> CI  Cr  racémico	Producto oleoso
345	HN * CF <sub>3</sub> racémico	Producto resinoide
346	F HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
347	HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso

[Tabla 1-64]

Compuesto nº	[Tabla 1-64] Estructura	Propiedad física
,		,
348	HN * CF <sub>3</sub>	p.f. 118 - 121°C
349	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 129 ~ 135°C
350	CI HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
351	HN CF <sub>3</sub> CI  CF <sub>3</sub> racémico  CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
352	HN * CF <sub>3</sub>	p.f. 197 ~ 198°C

[Tabla 1-65]

[Tabla 1-65]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
353	HN + CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub> racémico  OMe	p.f. 160 ~ 161°C
354	HN + CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
355	HN CF <sub>3</sub>	Producto resinoide
356		p.f. 112 ~ 114°C
357	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 122 ~ 123°C

[Tabla 1-66]

	[Tabla Too]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
358	HN Z = CI	p.f. 118 ~ 120°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
359	HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
360	CI N CF3	p.f. 91 ~ 93°C
361	HN OMe	Producto resinoide
362	CI N OMe	Producto resinoide
363	HN OMe	Producto oleoso

[Tabla 1-67]

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
364	HN CF <sub>3</sub>	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
365	HN OMe	Producto oleoso
366	HN OMe	Producto oleoso
367	HN CF <sub>3</sub>	p.f. 102 ~ 103°C
368	HN CF <sub>3</sub>	Producto oleoso
369	HN CF <sub>3</sub> O <sub>2</sub> N N MeO <sub>2</sub> S N	Producto resinoide

[Tabla 1-68]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
370	O <sub>2</sub> N N CI N	F <sub>3</sub> Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
371	HN CF <sub>3</sub> O <sub>2</sub> N N MeS N	Producto resinoide
372	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	p.f. 157 ~ 158°C
373	HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Producto resinoide
374	HN racémico	Producto oleoso
375	Br N racémico	Producto oleoso

	[Tabla 1-69]	<u>,                                      </u>
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
376	CI N racémico	p.f. 84 ~ 86°C

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
377	CI CF <sub>3</sub> Cr <sub>3</sub> racémico	Producto oleoso
378	T Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	p.f. 207 ~ 208°C
379	HZ Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	Producto resinoide
380	HN OMe	p.f. 158 ~ 161 °C

[Tabla 1-70]		
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
381	HN racémico	Producto oleoso

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
382	CI N racémico	Producto oleoso
383	CI CF <sub>3</sub> CI N racémico	Producto oleoso
384	HN * CF <sub>3</sub>	p.f. 176 ~ 180°C
385	CI CF <sub>3</sub> CI N racémico	Producto resinoide
386	HN CF <sub>3</sub>	Producto resinoide

	[Tabla 1-71]	
Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
387	HN * CF <sub>3</sub>	Producto resinoide

Compuesto nº	Estructura	Propiedad física
388	CI N racémico	p.f. 96 ~ 98°C
389	HN * racémico	Producto resinoide

[Tabla 2-1]

	[Tabla 2-1]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
1	2,05 (t, 1H), 2,60 (dt, 2H), 3,80 (q, 2H), 5,82 (brs, 1H), 7,18 (d, 2H), 7,28 (d, 2H), 8,51 (s, 1H)
2	0,05 (s, 9H), 2,47 (t, 2H), 3,63 (q, 2H), 5,52 (brs, 1H), 6,97 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 8,35 (s, 1H)
3	0,43-0,71 (m, 6H), 0,91-1,10 (m, 9H), 2,65 (t, 2H), 3,78 (q, 2H), 5,62 (brs, 1H), 7,10 (d, 2H), 7,29 (d, 2H), 8,50 (s, 1H)
4	1,06 (s, 21H), 2,67 (t, 2H), 3,81 (q, 1H), 5,51 (brs, 1H), 7,08 (d, 2H), 7,28 (d, 2H), 8,51 (s, 1H)
5	0,05 (s, 6H), 0,83 (s, 9H), 2,55 (t, 2H), 3,69 (q, 2H), 5,42 (brs, 1H), 7,00 (d, 2H), 7,19 (d, 2H), 8,41 (s, 1H)
6	0,90 (t, 3H), 1,26-1,53 (m, 4H), 2,08-2,24 (m, 2H), 2,46-2,66 (m, 2H), 3,74 (q, 2H), 5,68 (brs, 1H), 7,14 (d, 2H), 7,29 (d, 2H), 8,51 (s, 1H)
7	1,02 (d, 6H), 1,70-1,84 (m, 1H), 2,00-2,12 (m, 2H), 2,48-2,67 (m, 2H), 3,75 (q, 2H), 5,76 (brs, 1H), 7,14 (d, 2H), 7,28 (d, 2H), 8,50 (s, 1H)
8	1,21 (s, 9H), 2,55 (t, 2H), 3,74 (q, 2H), 5,52 (brs, 1H), 7,12 (d, 2H), 7,29 (d, 2H), 8,51 (s, 1H)
9	2,52-2,72 (m, 2H), 3,55-3,67 (m, 2H), 3,80 (q, 2H), 5,74 (brs, 1H), 6,97-7,35 (m, 7H), 8,46 (s, 1H)
10	2,79 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,67 (brs, 1H), 7,18-7,46 (m, 7H), 8,53 (s, 1H)
11	2,86 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 5,53 (brs, 1H), 6,96-7,40 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
12	2,83 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 5,53 (brs, 1H), 6,90-7,60 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
13	2,82 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 5,58 (brs, 1H), 6,88-7,44 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
14	2,85 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 5,72 (brs, 1H), 7,10-7,48 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
15	2,83 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 5,51 (brs, 1H), 6,96-7,63 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)

[Tabla 2-2]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
	2,83 (t, 2H), 3,86 (q, 2H), 5,59 (brs, 1H), 7,07-7,41 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
	2,39 (s, 3H), 2,81 (d, 2H), 3,89 (q, 2H), 5,60 (brs, 1H), 7,13-7,68 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
	2,27 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 5,56 (brs, 1H), 6,90-7,60 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
	2,31 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 3,86 (q, 2H), 6,07 (t, 1H), 7,01-7,31 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
20	1,29 (s, 9H), 2,81 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 5,87 (brs, 1H), 7,11-7,31 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
21	2,85 (t, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,86 (q, 4H), 6,03 (brs, 1H), 6,79-6,96 (m, 2H), 7,14-7,41 (m, 4H), 8,52
	(s, 1H)
	2,83 (t, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,88 (q, 2H), 5,58 (brs, 1H), 6,78-7,33 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
23	2,80 (t, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,82 (q, 2H), 5,82 (t, 1H), 6,83 (d, 2H), 7,11-7,36 (m, 4H), 8,52 (s, 1H)
24	2,82 (t, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,87 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 5,72 (brs, 1H), 6,72-7,31 (m, 5H), 8,53 (s, 1H)
	2,86 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,62 (brs, 1H), 7,18-7,70 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
	2,85 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 5,62 (brs, 1H), 7,11-7,67 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
	2,83 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 7,10-7,62 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
	2,83 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 7,18-7,72 (m, 5H), 8,54 (s, 1H)
29	2,80 (t, 2H), 3,88-4,08 (m, 5H), 6,94 (brs, 1H), 7,16-7,67 (m, 5H), 8,02 (d, 1H), 8,49 (s, 1H)
30	2,85 (t, 2H), 3,80-4,00 (m, 5H), 7,12-7,54 (m, 4H), 7,92-8,07 (m, 2H), 8,53 (s, 1H)
	2,86 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 3,90 (s, 3H), 5,76 (brs, 1H), 7,13-7,46 (m, 4H), 7,95 (d, 2H), 8,53 (s, 1H)
32	2,87 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,66 (brs, 1H), 7,06-7,51 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)

[Tabla 2-3]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
33	2,77 (t, 2H), 2,88 (q, 2H), 5,62 (brs, 1H), 7,12-7,33 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
34	2,83 (t, 2H), 2,78 (q, 2H), 5,55 (brs, 1H), 7,08-7,45 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
35	2,89 (t, 2H), 3,97 (q, 2H), 6,25 (brs, 1H), 7,22-7,61 (m, 6H), 8,50 (s, 1H)
36	2,86 (t, 2H), 3,89 (q, 2H), 7,13-7,64 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
37	2,88 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 7,17-7,82 (m, 6H), 8,51 (s, 1H)
38	2,86 (t, 2H), 3,96 (q, 2H), 7,21-7,61 (m, 5H), 8,04 (d, 1H), 8,50 (s, 1H)
39	2,85 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 5,58 (brs, 1H), 7,09-7,71 (m, 5H), 8,11 (d, 1H), 8,54 (s, 1H)
40	2,90 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,48 (brs, 1H), 7,11-7,57 (m, 5H), 8,12 (d, 1H), 8,54 (s, 1H)
41	2,85 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 5,55 (brs, 1H), 6,73-7,34 (m, 5H), 8,52 (s, 1H)
42	2,90 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,65 (brs, 1H), 6,90-7,34 (m, 5H), 8,52 (s, 1H)
43	2,83 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,50 (brs, 1H), 6,92-7,32 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
44	2,82 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 4,78 (d, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,13-7,41 (m, 6H), 8,50 (s, 1H)
45	2,83 (t, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,15 (brs, 1H), 7,15-7,45 (m, 6H), 8,51 (s, 1H)
46	1,22 (t, 3H), 2,83 (t, 2H), 3,50 (q, 2H), 3,92 (q, 2H), 4,65 (s, 2H), 6,20 (brs, 1H), 7,15-7,45 (m,
	6H), 8,51 (s, 1H)
47	2,86 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,25 (s, 1H), 5,74 (brs, 1H), 5,78 (s, 1H), 7,14-7,44 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
48	2,90 (t, 2H), 3,92 (t, 2H), 7,24-7,89 (m, 6H), 8,45 (s, 1H), 10,37 (s, 1H)
49	2,85 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,00 (brs, 1H), 7,18-7,71 (m, 6H), 8,64 (s, 1H)

[Tabla 2-4]

[Tabla 2-4]
valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
2,20 (s, 3H), 2,83 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 4,70 (s, 2H), 6,06 (brs, 1H), 7,10-7,62 (m, 5H), 8,66 (s, 1H)
2,56 (s, 3H), 2,87 (t, 2H), 3,32 (s, 3H), 3,87 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 5,92 (brs, 1H), 6,80 (s, 1H), 7,17-7,48 (m, 4H), 8,44 (s, 1H)
2,80 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 6,20 (brs, 1H), 6,34-6,36 (m, 1H), 7,12-7,57 (m, 4H), 8,50 (s, 1H)
2,82 (t, 2H), 3,84 (q, 2H), 5,88 (brs, 1H), 6,87-7,30 (m, 5H), 8,52 (s, 1H)
2,80 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,23 (brs, 1H), 7,02-7,38 (m, 5H), 0,52 (s, 1H)
2,85 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,24 (brs, 1H), 7,12-7,72 (m, 5H), 8,48-8,57 (m, 2H)
2,85 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,56 (brs, 1H), 7,12-7,34 (m, 4H), 7,58-7,78 (m, 1H), 8,45-8,68 (m, 3H)
2,87 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,62 (brs, 1H), 7,12-7,35 (m, 4H), 8,45-8,58 (m, 3H)
2,90 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 5,85 (brs, 1H), 7,15-7,27 (m, 3H), 8,50 (s, 1H), 8,75 (d, 2H)
2,42 (s, 6H), 2,90 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,30 (brs, 1H), 6,97 (s, 1H), 7,24-7,32 (m, 4H), 8,50 (s, 1H)
2,87 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 3,95 (s, 6H), 6,00 (s, 1H), 7,45 (d, 2H), 7,60 (d, 2H), 8,48 (s, 1H), 8,87 (s, 1H)
2,86 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 5,52 (brs, 1H), 7,15 (d, 2H), 7,30 (d, 2H), 7,89 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,68 (s, 1H)
3,86 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,86 (brs, 1H), 7,18-7,28 (m, 3H), 7,77 (d, 2H), 8,48 (s, 1H)
2, 88 (t, 3H), 3,90 (q, 2H), 6,04 (brs, 1H), 7,40 (d, 2H), 7,24 (s, 2H), 8,52 (s, 1H), 8,75 (d, 2H)
2,90 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 6,16 (brs, 1H), 7,17-7,27 (m, 3H), 8,50 (s, 1H)
2,51 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 5,92 (brs, 1H), 7,16-7,26 (m, 3H), 8,52 (s, 1H)

5 [Tabla 2-5]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
66	2,38 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,04 (brs, 1H), 7,17-7,25 (m, 3H), 8,51 (s, 1H)
67	2,82 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 4,09 (s, 3H), 5,74 (brs, 1H), 6,75 (s, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 8,51
	(s, 1H)
68	2,85 (t, 3H), 3,88 (q, 2H), 5,33 (s, 1H), 5,85 (brs, 2H), 7,15-7,42 (m, 3H), 8,51 (s, 1H)
69	2,90 (t, 3H), 3,91 (q, 2H), 5,75 (brs, 1H), 7,21-7,30 (m, 2H), 7,70 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 9,95 (s, 1H)
70	2,79 (t, 2H), 3,70 (q, 2H), 4,67 (d, 2H), 6,00 (t, 1H), 7,51 (s, 2H), 7,65 (s, 1H), 8,37 (s, 1H)
	0,13 (s, 6H), 0,95 (s, 9H), 2,83 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 4,92 (s, 2H), 5,82 (brs, 1H), 7,22-7,31 (m,
	3H), 8,51 (s, 1H)
72	2,83 (t, 3H), 3,48 (s, 3H), 3,87 (q, 2H), 4,70 (s, 2H), 6,09 (brs, 1H), 7,23-7,41 (m, 3H), 8,51 (s, 1H)
73	2,16 (s, 3H), 2,85 (t, 3H), 3,88 (q, 2H), 5,34 (s, 2H), 5,73 (brs, 1H), 7,15-7,36 (m, 3H), 8,51 (s, 1H)
	2,51 (t, 1H), 2,84 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 4,30 (d, 2H), 4,86 (s, 2H), 5,90 (brs, 1H), 7,17-7,35 (m,
	3H), 8,51 (s, 1H)
75	2,83 (t, 2H), 3,86 (q, 2H), 4,29 (s, 2H), 5,82 (brs, 1H), 7,13-7,30 (m, 8H), 8,51 (s, 1H)
76	2,87 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,82 (brs, 1H), 7,14-7,51 (m, 6H), 7,90-8,00 (m, 2H), 8,52 (s, 1H)
77	2,85 (t, 2H), 3,88 (q, 4H), 5,87 (brs, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,16-7,31 (m, 4H), 7,47 (t, 1H), 8,01 (s,
	1H), 8,52 (s, 1H)
78	2,82 (t, 2H), 3,86 (q, 2H), 5,93 (brs, 1H), 7,16-7,59 (m, 5H), 7,85-7,90 (m, 1H), 8,52 (s, 1H)

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
79	2,81 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,22 (t, 1H), 7,00-8,48 (m, 6H), 8,50 (s, 1H)
80	2,82 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 5,93 (brs, 1H), 7,16-7,59 (m, 5H), 7,85-7,90 (m, 1H), 8,52 (s, 1H)
81	2,89 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,77 (brs, 1H), 7,16-7,45 (m, 4H), 8,18-8,31 (m, 1H), 8,53 (s, 1H),
	8,64-8,70 (m, 1H), 9,15 (s, 1H)

# [Tabla 2-6]

[14514 2 0]
valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
2,86 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,85 (brs, 1H), 7,27 (s, 2H), 7,39-7,48 (m, 3H), 7,76 (s, 1H), 7,99-8,09
(m, 2H), 8,51 (s, 1H)
2,77 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 5,85 (brs, 1H), 6,85 (s, 1H), 7,11-7,41 (m, 7H), 8,49 (s, 1H)
2,90 (t, 2H), 3,15 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 7,10-7,80 (m, 5H), 8,52 (s, 1H)
2,95 (t, 3H), 3,87 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 5,84 (brs, 1H), 7,10-7,92 (m, 5H), 8,50 (s, 1H)
2,08 (t, 1H), 2,64 (dt, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,19 (brs, 1H), 7,44-7,91 (m, 4H), 8,67 (s, 1H)
0,17 (s, 9H), 2,67 (t, 2H), 3,83 (q, 2H), 6,12 (brs, 1H), 7,45-7,84 (m, 4H), 8,67 (s, 1H)
0,89 (t, 3H), 1,27-1,54 (m, 4H), 2,12-2,21 (m, 2H), 2,60 (dt, 2H), 3,78 (q, 2H), 6,32 (brs, 1H),
7,28-7,81 (m, 4H), 8,67 (s, 1H)
0,87 (t, 3H), 1,25-1,57 (m, 8H), 2,11-2,02 (m, 2H), 2,50-2,70 (m, 2H), 3,78 (q, 2H), 6,30 (brs, 1H),
7,19-7,81 (m, 4H), 8,67 (s, 1H)
0,61-0,87 (m, 4H), 1,13-1,25 (m, 1H), 2,57 (dt, 2H), 3,76 (q, 2H), 6,17 (brs, 1H), 7,19-7,90 (m,
4H), 8,66 (s, 1H)
1,26-1,79 (m, 10H), 2,39 (brs, 1H), 2,64 (t, 2H), 3,78 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,45-7,90 (m, 4H),
8,66 (s, 1H)
2,82 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 4,18 (s, 2H), 3,44 (d, 2H), 6,14 (brs, 1H), 7,41-7,82 (m, 4H), 8,66 (s, 1H)
1,99-2,07 (m, 3H), 2,84-2,99 (m, 2H), 3,78-4,02 (m, 2H), 6,00-6,18 (m, 1H), 6,61 (brs, 1H),
7,10-7,99 (m, 4H), 8,67 (brs, 1H)
1,53-1,66 (m, 4H), 2,03-2,10 (m, 4H), 2,74 (t, 2H), 3,83 (q, 2H), 6,04-6,16 (m, 2H), 7,19-7,82 (m,
4H), 8,67 (s, 1H)
3,88 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 5,70 (d, 2H), 7,11-8,02 (m, 9H), 8,68 (s, 1H)
2,88 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,18 (brs, 1H), 7,21-7,82 (m, 9H), 8,65 (s, 1H)
2,92 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,22 (brs, 1H), 7,12-7,91 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)

### [Tabla 2-7]

Compuecto nº	halor & (nom. dischapto: CDClo. sustancia patrón interno: TMS)
	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
98	2,90 (t, 2H), 4,00 (q, 2H), 7,00-8,35 (m, 9H), 8,65 (s, 1H)
99	2,89 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 5,24 (s, 1H), 5,77 (s, 1H), 6,46 (brs, 1H), 7,26-7,83 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
100	2,91 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,33 (brs, 1H), 6,95 (dd, 1H), 7,26-7,82 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
101	2,91 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,37-7,80 (m, 8H), 8,65 (s, 1H)
102	2,94 (t, 2H), 4,05 (q, 2H), 7,37-7,80 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
103	1,94 (t, 3H), 2,65-2,99 (m, 4H), 3,94 (q, 2H), 6,05 (brs, 1H), 7,19-7,83 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
104	1,20 (d, 6H), 2,91 (t, 2H), 3,40 (m, 1H), 3,94 (q, 2H), 6,22 (brs, 1H), 6,96-7,80 (8H), 8,68 (s, 1H)
105	1,72 (s, 3H), 2,59-2,98 (m, 4H), 2,88 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 4,67 (s, 2H), 6,09 (brs, 1H), 7,06-7,83
	(m, 8H), 8,68 (s, 1H)
106	0,82 (t, 3H), 1,16-1,68 (m, 4H), 2,55 (t, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 6,11 (brs, 1H), 6,91-7,81
	(m, 8H), 8,68 (s, 1H)
107	0,85 (t, 3H), 1,13-1,72 (m, 8H), 2,56 (t, 2H), 3,85 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,14 (brs, 1H), 6,96-7,81
	(m, 8H), 8,67 (s, 1H)
108	0,85 (t, 3H), 1,05-1,67 (m, 12H), 2,59 (t, 2H), 2,86 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,09 (brs, 1H), 6,98-7,81
	(m, 8H), 8,68 (s, 1H)
109	1,11-1,88 (m, 12H), 2,22-2,70 (m, 1H), 2,82 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,08-7,81 (m,
	8H), 8,67 (s, 1H)
110	2,88 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 5,26 (d, 1H), 5,72 (d, 1H), 6,39 (brs, 1H), 6,68 (dd, 2H), 7,26-8,00 (m,
	8H), 8,68 (s, 1H)
111	0,26 (s, 9H), 2,87 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 7,30-7,84 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
112	0,88 (t, 3H), 1,15-1,67 (m, 10H), 2,60 (t, 2H), 2,88 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,20-7,84
	(m, 12H), 8,69 (s, 1H)
113	2,87 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,25 (dd, 1H), 6,24 (brs, 1H), 7,18-7,91 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
114	2,73 (t, 2H), 3,75 (q, 2H), 5,83 (brs, 1H), 7,18-7,75 (m, 13H), 8,62 (s, 1H)

[Tabla 2-8]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
115	3,70 (t, 2H), 3,55 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 6,10 (brs, 1H), 6,82-7,40 (m, 8H), 8,23 (s, 1H)
116	2,45 (s, 3H), 2,86 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,27 (brs, 1H), 7,17-7,83 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
	2,47 (s, 3H), 2,86 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 6,18 (brs, 1H), 7,09-7,81 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
118	1,40 (t, 3H), 2,84 (t, 2H), 3,87-4,06 (m, 4H), 6,20 (brs, 1H), 6,75-7,80 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
119	1,30 (d, 6H), 3,84 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 4,55 (m, 1H), 6,43 (brs, 1H), 6,78-7,82 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
120	2,98 (t, 2H), 3,04 (s, 3H), 3,93 (q, 2H), 7,44-7,92 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
121	2,84 (t, 2H), 3,46 (s, 3H), 3,87 (q, 2H), 5,16 (s, 2H), 6,22 (d, 1H), 6,95 (d, 2H), 7,28-7,83 (m, 8H),
	8,68 (s, 1H)
122	2,70 (s, 6H), 2,92 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 6,40 (brs, 1H), 7,44-7,93 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
123	2,02 (s, 1H), 2,82 (t, 2H), 3,00 (s, 3H), 3,88 (q, 2H), 6,14 (brs, 1H), 7,07-7,90 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
	2,80 (s, 3H), 2,86 (t, 2H), 3,26 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 6,64 (brs, 1H), 7,22-7,88 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
	2,72 (t, 2H), 3,74 (s, 6H), 3,82 (q, 2H), 7,37-7,97 (m, 8H), 8,53 (s, 1H)
126	2,85 (s, 3H), 2,92 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,04 (brs, 1H), 7,31-7,80 (m, 9H), 8,64 (s, 1H)
	2,83 (t, 2H), 4,00 (q, 2H), 5,78 (brs, 1H), 7,35-8,08 (m, 8H), 8,37 (s, 1H)
128	2,60 (s, 3H), 2,91 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,37 (brs, 1H), 7,20-7,87 (m, 8H), 8,58 (s, 1H)
129	1,37 (t, 3H), 2,89 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 4,37 (q, 2H), 6,07 (brs, 1H), 7,38-7,98 (m, 8H), 8,65 (s, 1H)
130	2,86 (t, 2H), 3,93 (q, 2H), 4,79 (s, 2H), 6,73 (brs, 1H), 7,18-7,90 (m, 8H), 8,60 (s, 1H)

[Tabla 2-9]

	[Tabla 2 5]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
131	2,17 (brs, 1H), 2,79 (t, 2H), 3,84 (q, 2H), 4,55 (s, 2H), 6,17 (brs, 1H), 7,13-7,34 (m, 8H), 8,57 (s, 1H)
132	2,87 (t, 2H), 3,93 (q, 2H), 4,68 (d, 2H), 6,15 (brs, 1H), 7,26-7,85 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
133	2,92 (t, 2H), 3,32 (s, 3H), 4,03 (q, 2H), 4,58 (s, 2H), 7,16-7,81 (m, 7H), 8,27-8,35 (m, 2H)
134	2,92 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 5,02 (s, 2H), 6,23 (t, 1H), 6,43 (brs, 1H), 7,22-7,91 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
135	2,93 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 4,00 (t, 2H), 4,39 (s, 2H), 7,20-8,12 (m, 8H), 8,65 (s, 1H)
136	2,85 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,83 (q, 2H), 4,41 (s, 2H), 6,84 (brs, 1H), 7,18-7,88 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
137	1,40 (d, 3H), 2,91 (t, 2H), 3,20 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 4,71 (q, 1H), 6,85 (brs, 1H), 7,10-7,92 (m,
	8H), 8,70 (brs, 1H)
138	2,88 (t, 2H), 3,88 (t, 2H), 5,58 (q, 1H), 7,25-7,85 (m, 9H), 8,54 (s, 1H)
139	2,95 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,97 (brs, 2H), 4,54 (s, 2H), 6,79-7,84 (m, 8H), 8,24 (brs, 1H)
140	2,88 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,98 (q, 2H), 4,54 (s, 2H), 6,32 (brs, 1H), 7,22-8,01 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
141	2,93 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,57 (s, 2H), 6,50 (brs, 1H), 6,98-7,80 (m, 7H), 8,69 (brs, 1H)
142	2,88 (t, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,52 (s, 2H), 6,71 (brs, 1H), 6,96-7,90 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
143	2,88 (t, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,53 (s, 2H), 6,58 (brs, 1H), 7,27-8,01 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
144	2,31 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 4,56 (s, 2H), 6,62 (brs, 1H), 7,14-8,01 (m,
	7H), 8,67 (s, 1H)
145	2,35 (s, 3H), 2,87 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,56 (s, 2H), 6,51 (brs, 1H), 6,99-7,87 (m,
	7H), 8,67 (s, 1H)
146	2,85 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,88 (s, 2H), 6,28 (brs, 1H), 7,08-7,82 (m, 6H), 8,70 (s, 1H)

5

[Tabla 2-10]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
147	2,95 (t, 2H), 3,81 (s, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,54 (brs, 1H), 7,15-7,79 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
148	2,89 (t, 2H), 3,42 (s, 3H), 3,93 (q, 2H), 4,70 (s, 2H), 4,76 (s, 2H), 6,84 (brs, 1H), 7,18-7,90 (m,
	8H), 8,68 (s, 1H)
149	2,84 (t, 2H), 3,32 (s, 6H), 3,98 (q, 2H), 5,76 (s, 1H), 6,67 (brs, 1H), 7,13-8,00 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
150	1,24 (t, 5H), 2,92 (t, 2H), 3,44 (q, 4H), 3,96 (q, 2H), 5,82 (s, 1H), 6,66 (brs, 1H), 7,10-7,97 (m,
	8H), 8,67 (s, 1H)
151	1,24 (t, 6H), 2,88 (t, 2H), 3,58 (q, 2H), 3,92 (q, 2H), 5,48 (s, 1H), 6,10 (brs, 1H), 7,34-8,02 (m,
	8H), 8,69 (s, 1H)
152	2,01 (s, 3H), 2,91 (t, 2H), 3,83 (s, 2H), 3,96 (q, 2H), 6,42 (brs, 1H), 7,25-7,83 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)
153	1,21 (t, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,48 (q, 2H), 3,93 (q, 2H), 4,63 (s, 2H), 6,76 (brs, 1H), 7,17-7,94 (m,
	8H), 8,68 (s, 1H)
154	1,18 (d, 6H), 2,88 (t, 2H), 3,49-3,76 (m, 1H), 3,95 (q, 2H), 4,64 (s, 2H), 6,61 (brs, 1H), 7,18-7,81
	(m, 8H), 8,68 (s, 1H)
155	2,84 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 3,98-4,08 (m, 4H), 6,23 (s, 1H), 6,55 (brs, 1H), 7,24-7,98 (m, 8H), 8,66
	(s, 1H)
156	1,61-2,01 (m, 6H), 2,84 (t, 2H), 3,60 (m, 2H), 3,90 (q, 2H), 5,40 (s, 1H), 6,23 (brs, 1H), 6,91-7,90
	(m, 8H), 8,68 (s, 1H)
157	2,84 (t, 2H), 3,13 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 4,54 (t, 2H), 6,68 (d, 1H), 7,12-7,86 (m, 7H), 8,69 (s, 1H)
158	2,88-3,15 (m, 4H), 3,86-4,01 (m, 4H), 4,40 (brs, 1H), 7,08-8,13 (m, 9H), 8,61 (s, 1H)

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
159	2,87 (t, 2H), 2,94 (s, 6H), 3,88 (q, 2H), 6,60 (d, 1H), 7,22-7,79 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
160	2,04 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,21 (brs, 1H), 6,93-7,84 (m, 8H), 8,22 (brs, 1H), 8,68 (s, 1H)
161	2,77 (s, 6H), 2,83 (t, 2H), 3,97 (q, 2H), 7,15 (brs, 1H), 7,39-8,19 (m, 8H), 8,64 (s, 1H)
162	2,80 (s, 3H), 2,84 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 4,35 (s, 2H), 6,22 (d, 1H), 7,30-7,88 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)

### [Tabla 2-11]

	[1808 2-11]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
	2,91 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 6,91-7,84 (m, 7H), 8,69 (s, 1H)
164	2,90 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,00-7,83 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
	2,92 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,57 (brs, 1H), 7,20-7,90 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
	2,86 (t, 2H), 3,89 (q, 2H), 6,05 (brs, 1H), 7,00-7,84 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
	2,35 (s, 3H), 3,00 (t, 2H), 4,02 (q, 2H), 6,23 (brs, 1H), 7,04-8,27 (m, 7H), 8,71 (s, 1H)
	2,91 (t, 2H), 3,96 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,07-7,83 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
	2,88 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 6,33 (brs, 1H), 7,05-7,79 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
	2,90 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 7,37-7,83 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
	2,93 (t, 2H), 3,97 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,03-7,84 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
	2,92 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,13-7,81 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
	2,92 (t, 2H), 3,93 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,28-7,81 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
	2,97 (t, 2H), 4,00 (q, 2H), 6,22 (brs, 1H), 7,05-7,83 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
175	2,87 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,05 (brs, 1H), 7,13-7,84 (m, 7H), 8,69 (s, 1H)
	2,95 (t, 2H), 4,01 (q, 2H), 6,12 (brs, 1H), 7,18-7,82 (m, 7H), 8,69 (s, 1H)
	2,90 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 6,27 (brs, 1H), 7,19-7,84 (m, 7H), 8,69 (s, 1H)
178	2,93 (t, 2H), 3,92 (s, 3H), 4,00 (q, 2H), 6,55 (brs, 1H), 7,12-7,75 (m, 7H), 8,66 (s, 1H)

# [Tabla 2-12]

1)
, 8,67 (s, 1H)
1H)
), 8,70 (s, 1H)
1H)
, 9,16 (s, 1H)

5

# [Tabla 2-13]

	[Tabla 2-13]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
196	2,85 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 6,06 (brs, 1H), 7,11-7,93 (m, 6H), 8,30 (d, 1H), 8,69 (s, 1H)
197	2,95 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,15 (brs, 1H), 7,30-7,90 (m, 6H), 8,68 (s, 1H), 8,80 (s, 1H)
198	2,92 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,05 (brs, 1H), 7,44-7,85 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
199	2,81 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,28 (brs, 1H), 6,72-6,84 (m, 2H), 7,25-8,13 (m, 5H), 8,68
	(s, 1H)
200	2,54 (s, 3H), 2,90 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 7,03-8,03 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
201	2,85 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 4,52 (d, 2H), 5,32 (t, 1H), 7,28-7,87 (m, 5H), 8,25 (d, 1H), 8,52 (s, 1H),
	8,65 (s, 1H)
202	2,92 (t, 2H), 3,40 (t, 1H), 3,95 (q, 2H), 4,75 (d, 2H), 6,03 (brs, 1H), 7,47-7,84 (m, 6H), 8,57 (s,
	1H), 8,69 (s, 1H)
203	2,82 (t, 2H), 3,50 (s, 3H), 3,86 (t, 2H), 6,48 (d, 1H), 7,23-7,98 (m, 5H), 8,58 (s, 1H)
204	2,86 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 6,90-7,93 (m, 7H), 8,68 (s, 1H)
205	2,80 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,23 (brs, 1H), 7,02-7,38 (m, 7H), 8,52 (s, 1H)
206	2,44 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 6,55-6,90 (m, 3H), 7,26-7,91 (m, 4H), 8,68 (s, 1H)

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
207	2,90 (t, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 4,45 (s, 2H), 6,85 (brs, 1H), 6,97 (d, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,39-7,84 (m, 4H), 8,68 (s, 1H)
208	2,26 (s, 3H), 2,92 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 6,13 (brs, 1H), 6,80 (d, 1H), 7,08 (d, 1H), 7,38-7,91 (m, 4H), 8,68 (s, 1H)
209	2,83 (t, 2H), 3,90 (q, 2H), 4,57 (s, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,46-7,83 (m, 6H), 8,67 (s, 1H)
210	2,90 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 6,27 (brs, 1H), 7,26-7,82 (m, 5H), 8,67 (s, 1H), 8,74 (d, 1H)
211	2,67 (s, 3H), 2,90 (t, 2H), 3,84 (q, 2H), 6,07 (brs, 1H), 7,25 (s, 1H), 7,46-7,84 (m, 4H), 8,67 (s, 1H)

# [Tabla 2-14]

	[Table 2 14]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
212	2,87 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 4,06 (s, 3H), 6,25 (brs, 1H), 7,17 (s, 1H), 7,38-7,91 (m, 4H), 8,68 (s, 1H)
213	1,33 (t, 3H), 2,94 (t, 2H), 3,92 (q, 2H), 4,35 (q, 2H), 5,62 (brs, 1H), 7,20-7,35 (m, 2H), 8,32 (s,
	1H), 8,53 (s, 1H)
214	1,34 (t, 3H), 2,71 (s, 3H), 2,93 (t, 2H), 3,89 (q, 2H), 4,34 (q, 2H), 5,60 (brs, 1H), 7,13-7,34 (m,
	2H), 8,52 (s, 1H)
215	2,79 (t, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,84 (q, 2H), 6,44 (brs, 1H), 6,81-7,83 (m, 9H), 8,64 (s, 1H)
216	2,79 (t, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,82 (q, 2H), 6,69-7,83 (m, 9H), 8,65 (s, 1H)
217	2,80 (t, 2H), 3,77 (s, 3H), 3,83 (q, 2H), 6,81-7,88 (m, 9H), 8,64 (s, 1H)
218	2,82 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 6,23 (brs, 1H), 6,92 (s, 1H), 7,25-7,89 (m, 8H), 8,65 (s, 1H)
219	2,81 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,86 (brs, 1H), 6,91 (s, 1H), 7,25-7,88 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
220	2,83 (t, 2H), 3,87 (q, 2H), 6,55 (brs, 1H), 6,93 (s, 1H), 7,27-7,88 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
221	2,79 (t, 2H), 3,71 (q, 2H), 7,41-8,24 (m, 9H), 8,50 (s, 1H)
222	2,82 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,93 (s, 1H), 7,17-7,88 (m, 8H), 8,65 (s, 1H)
223	2,84 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 6,44 (brs, 1H), 6,97 (s, 1H), 7,27-7,81 (m, 9H), 8,66 (s, 1H)
224	2,74 (t, 2H), 3,77 (q, 2H), 6,85-7,85 (m, 9H), 8,63 (s, 1H)
225	2,83 (t, 2H), 3,88 (q, 2H), 6,32 (brs, 1H), 6,90-7,89 (m, 9H), 8,66 (s, 1H)
226	2,81 (t, 2H), 3,85 (q, 2H), 6,65 (brs, 1H), 6,85-7,88 (m, 9H), 8,66 (s, 1H)
227	2,78 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 6,84 (s, 1H), 7,26-7,87 (m, 9H), 8,65 (s, 1H)
228	1,65-1,76 (m, 6H), 2,85 (t, 2H), 3,36-3,46 (m, 4H), 3,90 (q, 2H), 6,28 (brs, 1H), 6,27 (s, 1H),
	7,25-8,00 (m, 4H), 8, 65 (s, 1H)

# [Tabla 2-15]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
229	1,48 (d, 3H), 2,81 (dd, 2H), 4,62-4,79 (m, 1H), 5,43 (d, 1H), 7,10-7,40 (m, 7H), 8,49 (s, 1H)
230	1,45 (d, 3H), 2,80 (d, 2H), 4,55-4,83 (m, 1H), 5,36 (d, 1H), 6,85-7,46 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
231	1,50 (d, 3H), 2,87 (dd, 2H), 4,64-4,91 (m, 1H), 5,58 (d, 1H), 7,06-7,48 (m, 6H), 8,51 (s, 1H)
232	1,46 (d, 3H), 2,81 (dd, 2H), 4,58-4,85 (m, 1H), 5,40 (d, 1H), 7,11-7,31 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
233	1,48 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,63-4,92 (m, 1H), 5,35 (d, 1H), 7,06-7,74 (m, 6H), 8,50 (s, 1H)
234	1,50 (d, 3H), 2,84 (d, 2H), 4,63-4,78 (m, 1H), 5,33 (d, 1H), 7,12-7,62 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
235	1,48 (d, 3H), 2,85 (d, 2H), 4,58-4,86 (m, 1H), 5,41 (d, 1H), 7,12-7,67 (m, 6H), 8,53 (s, 1H)
236	1,54 (d, 3H), 2,84 (dd, 2H), 3,86 (s, 3H), 4,65-4,90 (m, 1H), 5,58 (brs, 1H), 6,80-7,42 (m, 6H),
	8,50 (s, 1H)
237	1,47 (d, 3H), 2,62 (dd, 2H), 3,09 (s, 3H), 4,83-4,93 (m, 1H), 6,40 (d, 1H), 7,23-7,64 (m, 4H),
	8,04-8,15 (m, 1H), 8,53 (s, 1H)
238	1,48 (d, 3H), 2,85 (d, 2H), 4,64-4,80 (m, 1H), 5,15 (brs, 1H), 7,10-7,73 (m, 6H), 8,52 (s, 1H)
239	1,48 (d, 3H), 2,40 (s, 3H), 2,86 (dd, 2H), 4,64-4,80 (m, 1H), 5,48 (d, 1H), 7,05-7,42 (m, 6H), 8,52
	(s, 1H)
240	1,20 (t, 3H), 1,47 (d, 3H), 2,60 (q, 2H), 2,85 (dd, 2H), 4,56-4,83 (m, 1H), 5,38 (brs, 1H), 6,99-7,36
	(m, 6H), 8,51 (s, 1H)
241	[1,24 (d, 6H), 1,47 (d, 3H), 2,77-2,97 (m, 3H), 4,62-4,77 (m, 1H), 5,40 (d, 1H), 7,10-7,37 (m, 6H),
	8,51 (s, 1H)
242	1,30 (dd, 6H), 1,52 (d, 3H), 4,45-4,89 (m, 2H), 5,67 (d, 1H), 6,78-7,42 (m, 6H), 8,50 (s, 1H)
243	1,36 (d, 3H), 2,57-3,15 (m, 3H), 4,63-4,79 (m, 3H), 5,90 (d, 1H), 7,13-7,46 (m, 6H), 8,46 (s, 1H)
244	1,49 (d, 3H), 2,83 (dd, 2H), 3,71 (s, 1H), 4,60-4,87 (m, 1H), 4,75 (s, 2H), 6,13 (d, 1H), 6,78-7,56
	(m, 5H), 8,44 (s, 1H)

[Tabla 2-16]

valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
1,49 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,64-4,82 (m, 1H), 4,73 (s, 2H), 6,25 (d, 1H), 7,10-7,42 (m, 5H), 8,46
(s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,38 (s, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,63-4,79 (m, 1H), 5,40 (d, 1H), 6,69-7,39 (m, 5H), 8,51
(s, 1H)
1,51 (d, 3H), 2,89 (dd, 2H), 4,63-4,90 (m, 1H), 5,46 (d, 1H), 6,82-7,49 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,89 (dd, 2H), 4,71-4,84 (m, 1H), 5,40 (d, 1H), 6,93-7,72 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,88 (dd, 2H), 4,67-4,83 (m, 1H), 5,30 (brs, 1H), 7,09-7,61 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,86 (dd, 2H), 4,63-4,79 (m, 1H), 5,41 (d, 1H), 7,01-7,31 (m, 5H), 8,52
(s, 1H)
1,50 (d, 3H), 2,94 (dd, 2H), 4,68-4,95 (m, 1H), 5,60 (d, 1H), 7,04-7,52 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,50 (d, 3H), 2,96 (dd, 2H), 4,67-4,94 (m, 1H), 5,53 (d, 1H), 7,11-7,63 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,51 (d, 3H), 2,88 (dd, 2H), 4,64-4,91 (m, 1H), 5,32 (d, 1H), 7,10-7,81 (m, 5H), 8,52 (s, 1H)
1,50 (d, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,64-4,72 (m, 1H), 5,74 (d, 1H), 7,29-7,66 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,50 (d, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,67-4,84 (m, 1H), 5,51 (d, 1H), 6,95-7,44 (m, 5H), 8,50
(s, 1H)
1,52 (d, 3H), 2,92 (dd, 2H), 3,06 (s, 3H), 4,71-4,87 (m, 1H), 5,33 (d, 1H), 7,10-7,99 (m, 5H), 8,52
(s, 1H)
1,52 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,70-4,86 (m, 1H), 5,56 (d, 1H), 7,13-7,65 (m, 5H), 8,52 (s, 1H)
1,46 (d, 3H), 2,87 (dd, 2H), 4,70-4,83 (m, 1H), 5,32 (d, 1H), 7,09-7,63 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,63-4,79 (m, 1H), 5,42 (d, 1H), 6,88-7,30
(m, 5H), 8,51 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,92 (dd, 2H), 4,69-4,83 (m, 1H), 5,28 (d, 1H), 7,09-7,92 (m, 5H), 8,51 (s, 1H)

[Tabla 2-17]

[Tabla 2-17]
valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
1,52 (d, 3H), 2,94 (dd, 2H), 4,66-4,93 (m, 1H), 5,62 (d, 1H), 7,05-7,31 (m, 4H), 8,51 (s, 1H)
1,53 (d, 3H), 3,00 (dd, 2H), 4,65-4,95 (m, 1H), 5,40 (d, 1H), 7,00-7,58 (m, 4H), 8,52 (s, 1H)
1,50 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,35 (s, 6H), 2,91 (t, 2H), 4,60-4,90 (m, 1H), 5,32 (brs, 1H), 6,85-7,30
(m, 4H), 8,51 (s, 1H)
1,49 (d, 3H), 2,92 (dd, 2H), 4,71-4,86 (m, 1H), 5,57 (d, 1H), 7,15-7,42 (m, 3H), 7,92-8,01 (m, 1H),
8,50 (s, 1H), 8,68-8,74 (m, 1H)
1,47 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,66-4,80 (m, 1H), 5,33 (brs, 1H), 7,19-7,31 (m, 3H), 7,76-7,82 (m,
1H), 8,51 (s, 1H)
1,47 (d, 3H), 2,67 (s, 3H), 2,86 (dd, 2H), 4,67-4,82 (m, 1H), 5,70 (brs, 1H), 7,19 (s, 1H), 7,37-7,81
(m, 4H), 8,67 (s, 1H)
1,05 (t, 3H), 1,70-1,95 (m, 2H), 2,82 (dd, 2H), 4,49-4,59 (m, 1H), 5,42 (d, 2H), 7,05-7,41 (m, 7H),
8,50 (s, 1H)
0,98 (t, 3H), 1,17-2,07 (m, 4H), 2,82 (dd, 2H), 4,52-4,74 (m, 1H), 5,42 (d, 1H), 7,12-7,43 (m, 7H),
8,51 (s, 1H)
0,86-0,99 (m, 3H), 1,17-1,47 (m, 4H), 1,64-1,85 (m, 2H), 2,82 (dd, 2H), 4,49-4,71 (m, 1H), 5,31
(d, 1H), 7,11-7,46 (m, 7H), 8,50 (s, 1H)
1,60 (d, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,63-4,85 (m, 1H), 5,83 (brs, 1H), 7,20-7,83 (m, 9H), 8,67 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,62-4,88 (m, 1H), 6,80 (brs, 1H), 6,86-7,88 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
1,58 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,74-4,91 (m, 1H), 6,00 (brs, 1H), 7,03-7,89 (m, 8H), 8,61 (s, 1H)
1,48 (d, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,61-4,86 (m, 1H), 6,78 (brs, 1H), 7,14-7,84 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
1,51 (d, 3H), 2,91 (dd, 2H), 4,80 (brs, 1H), 5,82 (brs, 1H), 7,16-7,81 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
1,52 (d, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,64-4,83 (m, 1H), 6,80 (d, 1H), 7,31-7,81 (m, 8H), 8,68 (s, 1H)

[Tabla 2-18]

	[Table 2 To]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
276	1,52 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,83 (s, 3H), 4,62-4,95 (m, 1H), 6,15 (brs, 1H), 6,82-7,82 (m, 8H),
	8,68 (s, 1H)
277	1,52 (t, 3H), 2,88 (d, 2H), 4,55-4,92 (m, 1H), 5,84 (d, 1H), 7,37-7,91 (m, 8H), 8,69 (s, 1H)
278	1,48 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 3,33 (s, 3H), 4,60 (s, 2H), 4,74-4,92 (m, 1H), 6,34 (d, 1H), 7,19-7,90
	(m, 8H), 8,67 (s, 1H)
279	1,50 (d, 3H), 2,32 (s, 3H), 2,80 (dd, 2H), 4,52-4,85 (m, 1H), 6,78 (d, 2H), 7,06-7,82 (m, 8H), 8,66
	(s, 1H)
280	1,25 (d, 3H), 2,52 (dd, 2H), 3,86-4,08 (m, 1H), 6,81 (s, 1H), 7,26-7,99 (m, 7H), 8,50 (s, 1H)
281	1,60 (d, 3H), 3,00 (dd, 2H), 4,85-5,00 (m, 1H), 7,19-8,25 (m, 8H), 8,65 (s, 1H)
282	1,58 (d, 3H), 2,97 (dd, 2H), 4,71-5,00 (m, 1H), 6,52 (d, 1H), 7,26-7,97 (m, 8H), 8,59 (s, 1H)
283	1,60 (d, 3H), 3,00 (dd, 2H), 4,75-5,08 (m, 1H), 7,26-8,43 (m, 8H), 8,64 (s, 1H)

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
284	1,62 (d, 3H), 3,00 (d, 2H), 4,84-4,92 (m, 1H), 7,13-8,62 (m, 9H)
285	1,50 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,73-4,87 (m, 1H), 5,92 (d, 1H), 7,27-7,89 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
286	1,50 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,67-4,93 (m, 1H), 5,88 (d, 1H), 7,06-7,91 (7H), 8,67 (s, 1H)
287	1,57 (d, 3H), 2,93 (dd, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,76-5,05 (m, 1H), 6,90-6,85 (m, 8H), 8,70 (s, 1H)
288	1,56 (d, 3H), 2,97 (dd, 2H), 4,65-5,02 (m, 1H), 6,93 (d, 1H), 7,36-8,05 (m, 7H), 8,65 (s, 1H)
289	1,25 (d, 2H), 1,50 (d, 2H), 2,62-3,19 (m, 3H), 4,74-4,89 (m, 1H), 5,96 (d, 1H), 7,26-7,89 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
290	1,55 (d, 3H), 2,58-3,38 (m, 2H), 3,05 (s, 3H), 4,72-5,08 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 7,28-8,17 (m, 8H), 8,64 (s, 1H)
291	1,53 (d, 3H), 2,90 (d, 2H), 4,65-4,92 (m, 1H), 5,95 (brs, 1H), 7,17-8,00 (m, 6H), 8,62 (s, 1H)

## [Tabla 2-19]

	[Tabla 2-19]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
292	1,43 (d, 3H), 2,67 (s, 3H), 2,86 (dd, 2H), 4,52-4,82 (m, 1H), 5,75 (d, 1H), 7,37-7,81 (m, 5H), 8,67 (s, 1H)
293	1,50 (d, 3H), 2,85 (dd, 2H), 4,60-4,80 (m, 1H), 5,82 (brs, 1H), 6,85-7,80 (m, 5H), 8,62 (s, 1H)
294	1,07 (t, 3H), 1,74-1,99 (m, 2H), 2,86 (dd, 2H), 4,42-4,78 (m, 1H), 5,94 (d, 1H), 6,87-7,90 (m, 8H), 8,67 (s, 1H)
295	1,07 (t, 3H), 1,74-1,98 (m, 2H), 2,91 (dd, 2H), 4,44-4,78 (m, 1H), 5,96 (d, 1H), 7,04-7,91 (m, 7H), 8,67 (s, 1H)
296	2,94 (d, 2H), 5,23-5,50 (m, 3H), 5,96-6,27 (m, 2H), 7,22-7,83 (m, 9H), 8,69 (s, 1H)
297	2,93 (d, 2H), 5,23-5,50 (m, 3H), 5,96-6,33 (m, 2H), 6,86-7,90 (m, 8H), 8,70 (s, 1H)
298	1,06 (d, 3H), 1,13 (d, 3H), 2,00-2,40 (m, 1H), 2,86 (d, 2H), 4,41-4,60 (m, 1H), 5,94 (d, 1H), 7,21-7,90 (m, 9H), 8,66 (s, 1H)
299	2,95 (d, 2H), 3,96-4,12 (m, 2H), 4,50-4,68 (m, 1H), 6,70 (d, 1H), 7,02-7,83 (m, 9H), 8,64 (s, 1H)
300	2,08 (t, 1H), 2,97 (dd, 2H), 5,73 (m, 1H), 6,42 (d, 1H), 7,01-7,90 (m, 9H), 8,64 (s, 1H)
301	3,17 (d, 2H), 5,80 (m, 1H), 6,45 (d, 1H), 7,18-7,82 (m, 14H), 8,66 (s, 1H)
302	3,25 (d, 2H), 5,86 (m, 1H), 6,47 (d, 1H), 7,18-7,87 (m, 13H), 8,66 (s, 1H)
303	1,34 (t, 3H), 3,23 (dd, 2H), 4,34 (q, 2H), 5,14-5,32 (m, 1H), 6,87 (d, 1H), 7,21-7,93 (m, 9H), 8,67 (s, 1H)
304	1,33 (t, 3H), 2,93-3,36 (m, 2H), 4,33 (q, 2H), 5,08-5,38 (m, 1H), 6,69 (d, 1H), 7,26-7,91 (m, 8H), 8,66 (s, 1H)
305	2,78-3,42 (m, 2H), 2,84 (d, 3H), 4,92-5,17 (m, 1H), 6,65 (brs, 1H), 6,94 (d, 1H), 7,22-7,90 (m, 9H), 8,67 (s, 1H)
306	2,90 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,28 (brs, 1H), 7,31-7,69 (m, 7H), 8,71 (s, 1H)
307	2,86 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 6,18 (brs, 1H), 7,13-7,88 (m, 7H), 8,79 (s, 1H)

# [Tabla 2-20]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
308	2,89 (t, 2H), 3,95 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,20-7,84 (m, 7H), 8,65 (s, 1H)
309	2,86 (t, 2H), 3,91 (q, 2H), 6,05 (brs, 1H), 7,22-7,75 (m, 7H), 8,65 (s, 1H)
310	2,91 (t, 2H), 3,93 (q, 2H), 7,19-7,70 (m, 7H), 8,10 (brs, 1H), 8,58 (s, 1H)
311	2,87 (t, 2H), 3,50 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,59 (brs, 1H), 7,30-7,89 (m, 7H), 8,78 (s, 1H)
312	2,86 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,58 (brs, 1H), 7,13-7,84 (m, 7H), 8,64 (s, 1H)
313	2,91 (t, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 7,12-7,71 (m, 7H), 8,55 (brs, 1H), 8,58 (s, 1H)
314	2,89 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 7,12-7,76 (m, 7H), 8,55 (brs, 1H), 8,58 (s, 1H)
315	2,87 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,60 (brs, 1H), 7,30-7,72 (m, 7H), 8,71 (s, 1H)
316	2,86 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,53 (brs, 1H), 7,07-7,95 (m, 7H), 8,64 (s, 1H)
317	2,85 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,62 (s, 2H), 6,58 (brs, 1H), 7,26-7,93 (m, 7H), 8,64 (s, 1H)
318	2,90 (t, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,96-7,69 (m, 8H), 8,62 (s, 1H)
319	2,83 (t, 2H),,3,37 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,63 (s, 2H), 6,66 (brs, 1H), 7,21-7,89 (m, 6H), 8,62 (s, 1H)
320	2,86 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,60 (brs, 1H), 7,21-8,02 (m, 7H), 8,64 (s, 1H)
321	2,84 (t, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,65 (s, 2H), 6,76 (brs, 1H), 7,21-8,22 (m, 7H), 8,70 (s, 1H)
322	2,82 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,67 (s, 2H), 6,78 (brs, 1H), 7,21-8,36 (m, 7H), 8,66 (s, 1H)
323	2,88 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,61 (s, 2H), 6,73 (brs, 1H), 7,18-8,12 (m, 7H), 8,72 (s, 1H)

[Tabla 2-21]

	[1808 2-21]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
324	2,88 (t, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,61 (s, 2H), 6,73 (brs, 1H), 7,18-8,12 (m, 7H), 8,72 (s, 1H)
325	2,70 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 4,59 (s, 2H), 6,38 (brs, 1H), 7,15-7,61 (m, 7H), 8,73 (s, 1H)
326	2,49 (s, 3H), 2,88 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,48 (brs, 1H), 7,22-8,01 (m, 7H), 8,63 (s, 1H)
327	2,66 (s, 3H), 2,86 (t, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,62 (s, 2H), 6,64 (brs, 1H), 7,18-7,82 (m, 6H), 8,68 (s, 1H)
328	2,87 (t, 2H), 3,50 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,96 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 6,59 (brs, 1H), 7,30-7,89 (m, 7H), 8,78 (s, 1H)
329	2,87 (t, 2H), 3,32 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,93 (q, 2H), 4,53 (s, 2H), 6,62 (brs, 1H), 7,00-7,82 (m, 7H), 8,59 (s, 1H)
330	2,84 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 7,20-7,90 (m, 7H), 8,55 (s, 1H), 8,71 (s, 1H)
331	2,83 (t, 2H), 3,41 (s, 3H), 4,00 (q, 2H), 4,70 (s, 2H), 7,14-7,44 (m, 4H), 7,85-9,17 (m, 4H)
332	2,46 (s, 3H), 2,84 (t, 2H), 3,32 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 4,61 (s, 2H), 6,64 (brs, 1H), 7,26-8,09 (m, 7H), 8,61 (s, 1H)
333	2,86 (t, 2H), 3,20 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,56 (s, 2H), 6,68 (brs, 1H), 7,24-8,03 (m, 12H), 8,67 (s, 1H)
334	2,88 (t, 2H), 3,22 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 4,52 (s, 2H), 6,60 (brs, 1H), 7,08-8,01 (m, 11H), 8,69 (s, 1H)
335	2,85 (t, 2H), 3,22 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,58 (s, 2H), 6,80 (brs, 1H), 7,18-8,05 (m, 11H), 8,66 (s, 1H)
336	2,85 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,54 (s, 2H), 6,74 (brs, 1H), 7,00-7,96 (m, 11H), 8,67 (s, 1H)
337	2,88 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 2,97 (q, 2H), 4,56 (s, 2H),7,14-7,37 (m, 5H), 7,91-8,69 (m, 7H)
338	2,83 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,97 (q, 2H), 4,64 (s, 2H), 6,90 (brs, 1H), 7,25-7,95 (m, 6H), 8,75 (s, 1H)
339	2,86 (t, 2H), 3,35 (s, 3H), 3,92 (q, 2H), 4,59 (s, 2H), 4,83 (s, 2H), 6,74 (brs, 1H), 7,13-7,85 (m, 12H), 8,62 (s, 1H)

[Tabla 2-22]

	[Table 2 22]
Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
340	2,85 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,93 (q, 2H), 4,58 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 6,66 (brs, 1H), 7,15-7,83 (m,
	12H), 8,58 (s, 1H)
341	2,45 (s, 3H), 2,66 (s, 3H), 2,84 (t, 2H), 3,43 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 7,25-8,00 (m, 6H),
	8,68 (s, 1H)
342	2,86 (t, 2H), 3,94 (q, 2H), 7,30-8,91 (m, 11H)
343	1,50 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,67-4,98 (m, 1H), 5,93 (brs, 1H), 7,16-7,76 (m, 7H), 8,70 (s, 1H)
344	1,48 (d, 3H), 2,91 (dd, 2H), 4,65-4,97 (m, 1H), 6,16 (d, 1H), 7,09-7,90 (m, 6H), 8,63 (s, 1H)
345	1,53 (d, 3H), 2,93 (dd, 2H), 4,60-4,96 (m, 1H), 6,14 (d, 1H), 7,26-7,62 (m, 5H), 7,81-7,98 (m, 1H),
	8,64 (s, 1H)
346	1,51 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,63-4,93 (m, 1H), 6,98-7,69 (m, 6H), 8,61 (s, 1H)
347	2,48 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,80 (m, 1H), 5,81 (d, 1H), 7,09-7,79 (m, 6H), 8,64 (s, 1H)
348	1,51 (d, 3H), 2,92 (dd, 2H), 4,73-4,88 (m, 1H), 5,97 (d, 1H), 7,27-7,63 (m, 6H), 8,70 (s, 1H)
349	1,50 (d, 3H), 2,91 (dd, 2H), 4,67-4,93 (m, 1H), 5,94 (d, 1H), 7,23-7,88 (m, 6H), 8,77 (s, 1H)
350	1,53 (d, 3H), 2,90 (dd, 2H), 4,65-4,92 (m, 1H), 7,20-8,23 (m, 7H), 8,59 (s, 1H)
351	1,53 (d, 3H), 2,94 (dd, 2H), 4,69-4,98 (m, 1H), 6,53 (d, 1H), 7,26-7,61 (m, 4H), 8,04-8,18 (m, 2H),
	8,62 (s, 1H)
352	1,51 (d, 3H), 2,92 (dd, 2H), 4,06 (s, 3H), 4,62-4,98 (m, 1H), 5,93 (d, 1H), 7,05-7,63 (m, 6H), 8,69
	(s, 1H)
353	1,49 (d, 2H), 2,86 (dd, 2H), 4,08 (s, 3H), 4,80 (m, 1H), 5,88 (d, 2H), 7,04-7,61 (m, 6H), 8,70 (s, 1H)
354	1,52 (d, 3H), 2,70 (s, 3H), 2,92 (dd, 2H), 4,81 (brs, 1H), 6,16 (brs, 1H), 7,26-7,61 (m, 6H), 8,73 (s, 1H)
355	1,52 (d, 3H), 2,92 (dd, 2H), 4,62-4,97 (m, 1H), 6,02 (d, 1H), 7,38-7,79 (m, 5H), 8,63 (s, 1H)

5 [Tabla 2-23]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
356	2,15 (s, 3H), 2,75 (t, 3H), 3,74 (q, 2H), 5,28 (brs, 1H), 7,19-7,43 (m, 5H), 8,29 (s, 1H)
357	2,76 (t, 2H), 3,76 (q, 2H), 5,93 (brs, 1H), 7,23-7,46 (m, 5H), 8,30 (s, 1H)
358	2,74 (t, 2H), 3,60 (q, 2H), 5,44 (brs, 1H), 6,40 (s, 1H), 7,23-7,45 (m, 5H), 8,37 (s, 1H)
359	1,24 (d, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,55 (d, 2H), 4,68-4,99 (m, 1H), 6,29 (s, 1H), 7,25-7,60 (m, 4H), 8,06
	(s, 1H)
360	2,47 (s, 3H), 2,79 (t, 2H), 3,78 (q, 2H), 5,74 (brs, 1H), 7,44-7,61 (m, 3H), 8,38 (s, 1H)
361	2,34 (s, 3H), 2,47 (s, 3H), 2,79 (t, 2H), 3,41 (s, 3H), 3,76 (q, 2H), 4,57 (s, 2H), 5,80 (brs, 1H),
	7,06-7,34 (m, 3H), 8,39 (s, 1H)
362	2,46 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 3,41 (s, 3H), 3,76 (q, 2H), 4,60 (s, 2H), 5,85 (brs, 1H), 7,17-7,45 (m,
	4H), 8,39 (s, 1H)

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
363	2,04 (s, 3H), 2,78 (t, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,77 (q, 2H), 4,58 (s, 2H), 5,43 (brs, 1H), 7,18-7,45 (m, 4H), 8,24 (s, 1H)
364	2,08 (s, 3H), 2,79 (t, 2H), 3,79 (q, 2H), 5,26 (brs, 1H), 7,27-7,68 (m, 4H), 8,28 (s, 1H)
365	2,10 (s, 3H), 2,78 (t, 2H), 3,40 (s, 2H), 3,80 (q, 2H), 6,10 (brs, 1H), 7,18-7,70 (m, 4H), 8,32 (s, 1H)
366	2,82 (t, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,78 (q, 2H), 4,58 (s, 2H), 6,02 (brs, 1H), 7,22-7,45 (m, 4H), 8,30 (s, 1H)
367	2,82 (t, 2H), 3,78 (q, 2H), 6,04 (brs, 1H), 7,27-7,72 (m, 4H), 8,30 (s, 1H)
368	2,80 (t, 2H), 3,47 (brs, 2H), 3,77 (q, 2H), 5,36 (brs, 1H), 7,33-7,68 (m, 4H), 8,07 (s, 1H)
369	2,92 (s, 3H), 2,92 (t, 2H), 3,96 (q, 2H), 7,39-7,75 (m, 5H), 8,12 (s, 1H)
370	2,80 (t, 2H), 3,89 (q, 2H), 7,34-7,83 (m, 5H), 8,41 (s, 1H)
371	2,52 (s, 3H), 2,81 (t, 2H), 3,96 (q, 2H), 6,70 (brs, 1H), 7,42-7,58 (m, 4H), 8,40 (s, 1H)

[Tabla 2-24]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
372	2,70 (t, 2H), 3,63 (q, 2H), 3,98 (s, 2H), 7,19-7,35 (m, 10H), 7,91 (s, 1H)
373	2,66 (t, 2H), 3,62 (q, 2H), 5,20 (brs, 1H), 7,09-7,45 (m, 10H), 8,36 (d, 1H)
374	1,65 (dd, 3H), 2,75 (t, 2H), 3,82 (q, 2H), 5,92-6,17 (m, 2H), 7,22-7,48 (m, 5H), 8,45 (s, 1H)
375	1,70 (dd, 3H), 2,80 (t, 2H), 3,80 (q, 2H), 5,50-6,20 (m, 1H), 6,05 (brs, 1H), 7,15-7,38 (m, 5H), 8,50 (s, 1H)
376	1,65 (dd, 3H), 2,75 (t, 2H), 3,71 (q, 2H), 5,50-6,25 (m, 1H), 5,90 (brs, 1H), 7,19-7,44 (m, 5H), 8,55 (s, 1H)
377	1,68 (dd, 3H), 2,81 (t, 2H), 3,80 (q, 2H), 5,89 (dq, 1H), 5,91 (brs, 1H), 7,44-7,61 (m, 3H), 8,54 (s, 1H)
378	2,75 (t, 2H), 3,75 (q, 2H), 7,30 (s, 5H), 7,72 (t, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,22 (s, 1H)
379	2,84 (t, 2H), 3,89 (q, 2H), 5,61 (t, 1H), 6,41 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,23-7,47 (m, 5H), 8,39 (s, 1H)
380	2,88 (t, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 4,59 (s, 2H), 7,25-7,39 (m, 7H), 8,43 (s, 1H), 9,00 (brs, 1H)
381	1,45 (d, 3H), 1,70 (dd, 3H), 2,78 (dd, 2H), 4,35-4,68 (m, 1H), 5,40-6,20 (m, 2H), 5,85 (brs, 1H), 7,17-7,47 (m, 5H), 8,45 (s, 1H)
382	1,44 (d, 3H), 1,80 (d, 3H), 2,82 (t, 2H), 4,40-4,72 (m, 1H), 5,65 (d, 1H), 6,13 (q, 1H), 7,26-7,62 (m, 3H), 8,53 (s, 1H)
383	1,44 (d, 3H), 1,85 (d, 3H), 2,82 (t, 2H), 4,40-4,72 (m, 1H), 5,48 (q, 1H), 5,70 (d, 1H), 7,45-7,74 (m, 3H), 8,54 (s, 1H)
384	1,54 (d, 3H), 2,95 (dd, 2H), 4,68-4,99 (m, 1H), 7,16-7,67 (m, 4H), 8,57 (dd, 1H), 8,88 (s, 1H), 9,01 (dd, 1H)
385	1,43 (d, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,80 (d, 2H), 4,38-4,64 (m, 1H), 5,48 (brs, 1H), 7,44-7,62 (m, 3H), 8,36 (s, 1H)
386	1,42 (d, 3H), 2,57 (s, 3H), 2,78 (d, 2H), 4,32-4,62 (m, 1H), 5,50 (d, 1H), 7,45-7,61 (m, 3H), 8,30 (s, 1H)
387	1,34 (d, 3H), 2,50 (s, 3H), 2,80 (d, 2H), 4,37-4,62 (m, 1H), 5,57 (d, 1H), 7,46-7,62 (m, 3H), 8,36 (s, 1H)

[Tabla 2-25]

Compuesto nº	valor δ (ppm, disolvente: CDCl <sub>3</sub> , sustancia patrón interno: TMS)
388	1,34 (d, 3H), 2,80 (d, 2H), 4,37-4,62 (m, 1H), 5,57 (d, 1H), 7,46-7,62 (m, 3H), 8,36 (s, 1H)
389	1,43 (d, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,74 (dd, 2H), 4,42-4,59 (m, 1H), 5,55 (d, 1H), 7,22-7,47 (m, 5H), 8,34
	(s, 1H)

EJEMPLO 2 [Ejemplos de agentes farmacéuticos] Ejemplo 1 de agente farmacéutico: Emulsión

10 partes del compuesto de la presente invención se disolvieron en 45 partes de 1,2-dimetil-4-eilbenceno y 35 partes de 1-metil-2-pirrolidinona. A continuación, 10 partes de SORPOL 3005X (el nombre comercial de un tensioactivo fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) se añadieron a la disolución, y la disolución mezclada a continuación se agitó y se combinó para obtener una emulsión al 10 %.

Ejemplo 2 de agente farmacéutico: polvo que se puede humedecer

15 10 partes del compuesto de la presente invención se añadieron a 2 partes de laurilsulfato de sodio, 4 partes de lignosulfonato de sodio, 20 partes de carbono blanco y 64 partes de arcilla. La mezcla obtenida se agitó y se combinó mediante una licuadora, para obtener un polvo que se puede humedecer al 10 %.

Ejemplo 3 de agente farmacéutico: gránulos

20

5

2 partes de dodecilbencenosulfonato, 2 partes de carboximetilcelulosa, 2 partes de laurilsulfato de sodio, 10 partes de bentonita y 79 partes de arcilla se añadieron a 5 partes del compuesto de la presente invención. La mezcla

obtenida se agitó y combinó completamente. A continuación, se añadió a lo resultante una cantidad adecuada de agua, y la mezcla se agitó adicionalmente. El producto de reacción se granuló en un granulador, seguido por secado en circulación, para obtener gránulos al 5 %.

5 Ejemplo 4 de agente farmacéutico: agente en polvo

1 parte del compuesto de la presente invención se disolvió en 2 partes de aceite de soja. A continuación, 5 partes de carbono blanco, 0,3 partes de fosfato de isopropilo ácido (PAP) y 91,7 partes de arcilla se añadieron a esta mezcla, y la mezcla obtenida se agitó y se combinó a continuación mediante una licuadora, para obtener un agente en polvo al 1 %.

Ejemplo 5 de agente farmacéutico: agente fluido

- 20 partes del compuesto de la presente invención se mezclaron con 20 partes de agua que comprendía 2 partes de alquil éter polioxietilenado, 1 parte de dialquil sulfosuccinato de sodio y 0,2 partes de 1,2-bencisotiazolina-3-ona. La mezcla obtenida se sometió a molienda usando Dinomill, y el producto de reacción se mezcló a continuación con 60 partes de agua que comprendía 8 partes de propilenglicol y 0,32 partes de goma xantana, para obtener una suspensión al 20 % en agua. Ejemplo 6 de agente farmacéutico: polvo granulado que se puede humedecer
- 20 2 partes de laurilsulfato de sodio, 3 partes de alquilnaftalenosulfonato de sodio, 5 partes de dextrina, 20 partes de carbono blanco y 50 partes de arcilla se añadieron a 20 partes del compuesto de la presente invención. La mezcla obtenida se agitó y combinó completamente. A continuación, se añadió a lo resultante una cantidad adecuada de agua, y la mezcla obtenida se agitó adicionalmente. El producto de reacción se granuló en un granulador, seguido por secado en circulación, para obtener un polvo granulado que se puede humedecer al 20 %.

EJEMPLO 3 [Ensayo de los efectos]

- (1) Ensayo que examina el efecto de control sobre Phytophthora infestans
- Mediante una pistola pulverizadora se pulverizó una disolución preparada ajustando un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto demuestra a 125 ppm (denominado a partir de ahora en el presente documento como "disolución de muestra de agente") sobre plantas de tomate en macetas (variedad: Sugar Lamp, estado foliar 4.5) a una concentración de 15 ml/maceta. Un día después de la pulverización una suspensión de zoosporas de Phytophthora infestans (concentración de zoosporas: 1,0 x 10<sup>4</sup> células/ml) se aplicó a las plantas mediante inoculación por pulverización. Las plantas se dejaron a 21 °C en condiciones de cámara húmeda durante 1 día, y a continuación se dejaron en un invernadero durante 3 días, para que quedaran totalmente infectadas con la enfermedad citada. A continuación, se examinó el nivel de enfermedad en cada hoja, y se calculó un valor preventivo mediante la siguiente fórmula.
- Cálculo del valor preventivo:

  Valor preventivo = {índice del área de la lesión no tratada índice del área de la lesión tratada) / índice del área de la lesión no tratada} x 100

El efecto de control de cada compuesto se determinó utilizando el valor preventivo así calculado de acuerdo con los siguientes estándares. Los resultados se muestran en la Tabla 3.

Efecto de control alto: 100% ≥ valor preventivo ≥ 60% Efecto de bajo control: 60% >valor preventivo ≥ 0%

[Tabla 3]

Ensayo de control sobre el efecto de Phytophthora infestans	
Resultado de la de	terminación del efecto de control
Determinación del	Tabla 1, Compuesto nº
efecto de control	
Efecto de control: alto	2, 7, 8, 10, 11, 17, 21, 23, 25, 32-51, 55, 58, 60-63, 65, 67-75, 84, 85, 87, 89, 91-93, 96, 97, 99-105, 107, 110, 115-121, 125-128, 130, 131, 133, 134, 139-141, 142-148, 151, 153, 154, 156, 161, 163, 164, 166, 168-172, 174, 177-180, 183, 184, 193, 195, 199, 200, 204-208, 210-212, 215, 216, 223-227, 230-233, 235, 237-241, 243-247, 249, 250, 255-260, 264-266, 271-276, 278, 279, 283, 285, 286, 290, 292, 293, 296, 298, 299, 306, 311, 315-319, 323, 325, 329, 330, 343, 355-357, 361-363, 365, 366, 375, 376, 380, 381
Efecto de control: bajo	1, 3-6, 9, 12-16, 18-20, 22, 24, 26-31, 52-54, 56, 57, 59, 64, 66, 76-83, 86, 88, 90, 94, 95, 98, 106, 108, 109, 111-114, 122-124, 129, 132, 135-138, 149, 150, 152, 155, 157-160, 162, 165, 167, 173, 175, 176, 181, 182, 185-192, 194, 196-198, 201-203, 209, 213, 214, 217-222, 228, 229, 234, 236, 242, 248, 251-254, 261, -263, 267-270, 277, 280-282, 284, 287-289, 291, 294, 295, 297, 300-305, 307-310, 312-314, 320-322, 324, 326-328, 331-342, 344-354, 358-360, 364, 367-374, 377-379, 382-389

10

#### (2) Ensayo que examina el efecto de control sobre Pseudoperonospora cubensis

Mediante una pistola pulverizadora se pulverizó una disolución preparada ajustando un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto demuestra a 125 ppm (denominado a partir de ahora en el presente documento como "disolución de muestra de agente") sobre plantas de pepino en macetas (variedad: Sagamihanjiro, estado foliar 2.5) a una concentración de 15 ml/maceta. Un día después de la pulverización una suspensión de conidios de Pseudoperonospora cubensis (concentración de conidios: 1,0 x 10<sup>4</sup> células/ml) se aplicó a las plantas mediante inoculación por pulverización. Tras finalizar la inoculación, las plantas se dejaron a 21 °C en condiciones de cámara húmeda durante 1 día, y a continuación se dejaron en un invernadero durante 3 días, para que quedaran totalmente infectadas con la enfermedad citada. A continuación, se comparó el nivel de enfermedad de cada hoja con el de la hoja sin tratar, y el efecto de control de cada compuesto se determinó de las misma forma que en el Ejemplo 3(1). Los resultados se muestran en la Tabla 4.

[Tabla 4]

Ensayo de control sobre el efecto de Pseudoperonospora cubensis		
Resultado de la determinación del efecto de control		
Determinación del efecto de	Tabla 1, Compuesto nº	
control		
	2, 3, 5, 7-27, 29-51, 52-56, 58, 60-76, 78-137, 139-148, 151-159, 161-185, 187-	
Efecto de control: alto	219, 221-254, 256-257, 258, 259, 260, 261, 262, 263-300, 303-357, 360-368,	
	374-377, 380-389	
Efecto de control: bajo	1, 4, 6, 28, 57, 59, 138, 149, 150, 160, 186, 220, 301, 302, 358, 359, 369-373,	
Liecto de control. Dajo	378, 379	

(3) Ensayo que examina el efecto de control sobre Sphaerotheca fuliginea

Mediante una pistola pulverizadora se pulverizó una disolución preparada ajustando un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto demuestra a 125 ppm (denominado a partir de ahora en el presente documento como "disolución de muestra de agente") sobre plantas de pepino en macetas (variedad: Sagamihanjiro, 2ª estado foliar) a una concentración de 15 ml/maceta. Un día después de la pulverización, una suspensión de conidios de Sphaerotheca fuliginea (concentración de conidios: 1,0 x 10⁵ células/ml) se aplicó a las plantas mediante inoculación por pulverización. Las plantas se dejaron en un invernadero durante 14 días, para que quedaran totalmente infectadas con la enfermedad citada. A continuación, se comparó el nivel de enfermedad de cada hoja con el de la hoja sin tratar, y el efecto de control de cada compuesto se determinó de las misma forma que en el Ejemplo 3(1). Los resultados se muestran en la Tabla 5.

[Tabla 5]

	[Tabla 5]	
Ensayo de control sobre el efecto de Sphaerotheca fuliginea		
Resultado de la determinación	del efecto de control 1	
Determinación del efecto de	Tabla 1, Compuesto no and the	
control		
Efecto de control: alto	2, 3, 5-20, 22-27, 29, 32-56, 61-63, 65, 67, 68, 70-76, 78-80, 82, 83, 85-91, 93, 94, 96-105, 107, 109-111, 113-121, 127, 128, 130, 131, 133, 134, 136, 137, 139-148, 151, 154, 156-159, 163-184, 186, 189, 193-201, 204, 205, 207, 208, 210-217, 219-227, 229-239, 241-253, 255-256, 257-275, 277-279, 281-298, 300, 304, 306-323, 325, 326, 328, 329, 343-356, 358, 360-368, 374-377, 379-389	
Efecto de control: bajo	1, 4, 21, 28, 30, 31, 57-60, 64, 66, 69, 77, 81, 84, 92, 95, 106, 108, 112, 122-126, 129, 132, 135, 138, 149, 150, 152, 153, 155, 161, 162, 185, 187, 188, 190-192, 202, 203, 206, 209, 218, 228, 254, 276, 280, 299, 301-303, 305, 324, 327, 330-342, 357, 359, 369-373, 378	

### 30 (4) Ensayo que examina el efecto sobre Aphis gossypii

Una sección de hoja de pepino con un diámetro de 3 cm se colocó sobre una esponja húmeda en un recipiente de plástico. A continuación, se liberaron en el recipiente de plástico cinco hembras adultas de Aphis gossypii, y se dejaron reposar durante la noche. A continuación, se contó el número de larvas recién nacidas. 0,4 ml de cada disolución de agente preparada diluyendo un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto mostrado en la Tabla 1 hasta una concentración de 250 ppm se pulverizó sobre lo anterior. Dos días después, se contó el número de muertes, y se calculó la tasa de mortalidad. Una tasa de mortalidad del 95 % o superior se calificó como A, una tasa de mortalidad del 80 % o superior a menos del 95 % se calificó como B, y una tasa de mortalidad del 60 % o superior a menos del 80 % se calificó como C. Los resultados se muestran en la Tabla 6.

40

10

15

20

### [Tabla 6]

Ensayo del efecto sobre Aphis gossypii	
Resultado de la	determinación del efecto
Determinación	Tabla 1, Compuesto nº
A	3, 6, 7, 10, 11, 14, 19, 21, 44-49, 53, 54, 87, 88, 91, 99, 100, 102, 103, 107, 108, 113, 133, 137, 139-145, 147-151, 153, 154, 158, 161, 180, 181, 197, 206-208, 229-235, 237, 239-246, 248-252, 255-262, 265-268, 270-275, 277-282, 285-290, 292, 294, 296-300, 304, 306, 312-321, 323, 325, 326, 328, 331, 333, 335, 337, 343-349, 351-353, 355, 360-362, 365, 366, 374, 376, 377, 380, 382-389
В	1, 8, 12, 13, 17, 22, 23, 32, 89, 93, 106, 122, 130, 169, 170, 178, 204, 205, 211, 236, 238, 247, 254, 276, 283, 284, 310, 336, 350, 354, 367
С	2, 9, 15, 16, 25, 31, 33-37, 64, 67, 74, 83, 86, 90, 94, 98, 104, 109, 117, 124, 152, 155, 159, 160, 163, 168, 182, 184, 185, 187, 190, 194, 199, 210, 212, 221, 224, 253, 263, 264, 269, 307, 309, 311, 324, 334, 363, 364, 375, 381

### (5) Ensayo que examina el efecto sobre hembras adultas de Tetranychus urticae

Una sección de hoja de frijol con un diámetro de 3 cm se colocó sobre una esponja húmeda en un recipiente de plástico. A continuación, se liberaron en el recipiente de plástico diez hembras adultas de Tetranychus urticae. 0,4 ml de cada disolución de agente preparada diluyendo un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto mostrado en la Tabla 1 hasta una concentración de 250 ppm se pulverizó sobre lo anterior. Dos días después, se contó el número de muertes, y se calculó la tasa de mortalidad. Una tasa de mortalidad del 95 % o superior se calificó como A, una tasa de mortalidad del 80 % o superior a menos del 95 % se calificó como B, y una tasa de mortalidad del 60 % o superior a menos del 80 % se calificó como C. Los resultados se muestran en la Tabla 7.

#### [Tabla 7]

Ensayo del efecto sobre Tetranychus urticae female adults		
Resultado de la determi	Resultado de la determinación del efecto	
Determinación	Tabla 1, Compuesto nº	
A	51, 95, 106-109, 113, 124, 133, 136, 139, 153, 181, 240, 249, 259, 262, 271, 273, 277, 278, 281-283, 285, 286, 288-290, 296, 297, 304, 331, 333, 337, 344-347, 350-353, 355, 362, 376, 382-387	
В	188, 206, 232, 233, 241, 246, 253, 258, 348, 349, 356	
С	27, 29, 38, 45, 64, 67, 83, 84, 88, 98, 102, 126, 127, 155, 182, 205, 226, 238, 263, 264, 267, 360	

### 15 (6) Ensayo que examina el efecto sobre huevos de Tetranychus urticae

Una sección de hoja de frijol con un diámetro de 3 cm se colocó sobre una esponja húmeda en un recipiente de plástico. A continuación, se liberaron en el recipiente de plástico diez hembras adultas de Tetranychus urticae, y se dejó transcurrir la ovipuesta a temperatura ambiente durante la noche. A continuación, se retiraron los adultos hembra liberados. se pulverizaron 0,4 ml de cada disolución de agente preparada diluyendo un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto mostrado en la Tabla 1 hasta una concentración de 250 ppm. Seis días después, se contó el número de huevos no eclosionados, y se calculó la tasa ovicida. Una tasa ovicida del 95 % o superior se calificó como A, una tasa ovicida del 80 % o superior a menos del 95 % se calificó como B, y una tasa ovicida del 60 % o superior a menos del 80 % se calificó como C. Los resultados se muestran en la Tabla 8.

25

20

#### [Tabla 8]

	[Tabla 0]
Ensayo del efecto sobre huevos de Tetranychus urticae	
Resultado de la determinación del efecto	
Determinación	Tabla 1, Compuesto nº
Α	113, 235, 238, 241, 249, 259, 262, 277, 285, 288, 289, 350, 355, 376, 377, 382, 384, 385
В	107, 109, 232, 233, 239, 245, 246, 257, 286, 348, 356
С	10. 16. 19. 20. 22. 24. 30. 38. 82. 95. 231. 240. 247. 248. 253. 258. 267. 269. 283

## (7) Ensayo que examina el efecto sobre Spodptera litura

Una sección de hoja de col china con un diámetro de 3 cm se sumergió en una disolución de agente preparada diluyendo un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto mostrado en la Tabla 1 hasta una concentración de 500 ppm, y a continuación se sometió a secado por aire. A continuación, la hoja de col china se colocó en una placa petri de plástico, y se liberaron sobre la misma 10 larvas de Spodptera litura en su tercer estadío. Dos días después del tratamiento, se contó el número de muertes, y se calculó la tasa de mortalidad. Una tasa de mortalidad del 95 % o superior se calificó como A, una tasa de mortalidad del 80 % o superior a menos del 95 % se calificó como B, y una tasa de mortalidad del 60 % o superior a menos del 80 % se calificó como C. Los resultados se muestran en la Tabla 9.

### [Tabla 9]

Ensayo del efe	ecto sobre Spodptera litura
Resultado de la	a determinación del efecto
Determinación	Tabla 1, Compuesto nº
Α	99, 102, 133, 139, 143, 144, 238, 249, 250, 257, 258, 275, 27 7, 278, 285, 286, 288, 289, 331,
	337, 343-345, 347, 348, 352, 353, 355, 374, 382
В	27, 279, 282, 297, 375, 377, 384, 387
С	13, 14, 16, 19, 52, 55, 112, 113, 121, 130, 137, 154, 177, 224, 232, 235, 264, 268, 271, 273, 290,
	296, 317, 319, 332, 336, 360, 380, 381

#### (8) Ensayo que examina el efecto sobre Meloidogyne incognita

1 ml de una disolución diluida que se preparó diluyendo un 10% de polvo que se puede humedecer de cada compuesto mostrado en la Tabla 1 hasta una concentración de 5000 ppm se colocó en un tubo de ensayo. Se añadieron al tubo de ensayo 9 ml de agua destilada que contenía aproximadamente 200 gusanos de Meloidogyne incognita, y se dejó reposar a temperatura ambiente durante 48 horas. Posteriormente, los gusanos tratados con agente se eliminaron por lavado, y se determinó al microscopio si estaban vivos o muertos. A continuación, se calculó la tasa de mortalidad de los gusanos. Una tasa de mortalidad del 95 % o superior se calificó como A, y una tasa de mortalidad del 80 % o superior a menos del 95 % se calificó como B. Los resultados se muestran en la Tabla 10

[Tabla 10]

Ensayo del efecto sobre Meloidogyne incognita	
Resultado de la determinación del efecto	
Determinación	Tabla 1, Compuesto nº
В	10-14

15

### Aplicabilidad industrial

Puesto que el compuesto novedoso representado por la fórmula general [I] de la presente invención presenta especialmente una actividad de control excelente sobre las plagas que podrían dañas plantas agrícolas y hortícolas, tales como patógenos, insectos, ácaros y nematodos, resulta extremadamente útil como agroquímico novedoso.

#### REIVINDICACIONES

1. Un derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la siguiente fórmula general [I]:

[Fórmula 1]

R<sup>2</sup>

HN

R<sup>3</sup>

N

[1]

[donde

R<sup>1</sup> se selecciona de entre

10

15

20

25

30

40

45

5

a) un anillo monocíclico o bicíclico que puede contener de 0 a 3 heteroátomos seleccionados entre el grupo que consiste en fenilo, bencilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, benzofurilo, isobenzofurilo, dihidrobenzofurilo, tiazolilo, isotiazolilo, naftilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinoxalilo, quinazolinilo, piridilo, quinolilo, isoquinolilo, benzotiazolilo, benzotiazolilo, pirrolilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, tienilo, benzotienilo, imidazolilo, bencimidazolilo, pirazolilo, y piridonilo,

b) alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono, o cicloalquenilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono,

c) -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representa cada uno un alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes), y

d) un átomo de hidrógeno, donde

en el caso de a) o b) anteriores, se puede sustituir  $R^1$  con -C(O)OR, -C(O)R, -R, -OR, -SR, -SO<sub>2</sub>R, -OC(O)R, -C(O)NHR, -C(O)NHR, -NHSO<sub>2</sub>R, -NHSO<sub>2</sub>R, -NHR, -NR<sub>2</sub>, -NHC(O)R, -NRC(O)R, -NHC(O)OR, -NRC(O)OR, -NHC(O)OR, -NHC(O)OR

N(OR)C(O)OR, -NHSO<sub>2</sub>R, -NRSO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>NHR, -SO<sub>2</sub>NR<sub>2</sub> (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), -SiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, -OSiR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup> (donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan cada uno alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono o fenilo; dos o todos de los cuales pueden ser los mismos sustituyentes, o todos de los cuales pueden ser diferentes sustituyentes), haloalquilo, haloalquenilo, haloalcoxi, acilacoxi, acilacoxi, aciloxialquilo, alquilsulfonilalquilo, siloxialquilo, hidroxialquilo, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxiacetal, alcoxialcoxi, cianoalquilo, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, pentahalosulfanilo, bencilo, benciloxi, fenilo, fenoxi, piridilo, oxazolilo, furilo, tiazolilo, naftilo, pirimidinilo, tienilo, benzotiazolilo, benzotiazolilo, imida, formilo (-CHO), carboxilo (-COOH), formamida (-NHCHO), éter cíclico, y

35 amina cíclica,

R² representa un átomo de hidrógeno, -R, -OR, -C(O)OR, -C(O)NHR, -CONR₂ (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), hidroxialquilo, alcoxialquilo, heteroalcoxialquilo, fenilo, heteroarilo, halógeno, ciano, haloalquilo, o haloalcoxi, R³ representa (1) un átomo de hidrógeno, (2) un átomo de halógeno, (3) alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con aciloxi representado por 1 a 4 grupos –CO-O- (un grupo hidrocarburo alifático lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos), 1 a 13 átomos de halógeno, o 1 a 4 grupos hidroxilo, (4) alquilo no sustituido que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, (5) –OR, -SR, o – SO₂R (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos

ramificado que contiene de 2 a 8 atomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 atomos de carbono, o cicloalquilo que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), o (6) haloalquilo, y  $R^4$  representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono,

nitro, amino, fenilo, bencilo, o junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina, un anillo de piridina como resultado de la unión con R<sup>3</sup> forma un anillo de tiofeno, un anillo de piridina como resultado de la unión con la consecución de la unión con la consecución de la consecución de

- 2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>4</sup> representa un anillo de tiofeno que se forma junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup>.
- 3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>4</sup> representa un anillo de benceno que se forma junto con un átomo de carbono en un anillo de pirimidina como resultado de la unión con R<sup>3</sup>.

- 4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R³ representa alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono que está sustituido con uno o más átomos de halógeno, y R⁴ representa un átomo de halógeno.
- 5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, fenilo, heteroarilo, -R, -C(O)OR, -C(O)NHR (donde R representa alquilo lineal o ramificado que contiene de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo lineal o ramificado que contiene de 3 a 8 átomos de carbono), hidroxialquilo, o alcoxialquilo.
- 6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹ se selecciona entre un anillo monocíclico o bicíclico que puede contener de 0 a 3 heteroátomos seleccionados entre el grupo que consiste en fenilo, oxazolilo, furilo, tiazolilo, naftilo, pirimidinilo, piridilo, benzotiazolilo, pirrolilo, benzoxazolilo, pirazinilo, tienilo, e imidazolilo.
- 7. Un método para producir el derivado de 4-(3-butinil) aminopirimidina representado por la fórmula general [I] de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar el derivado de 4-clorotienopirimidina [II] representado por la siguiente fórmula general [II]:

#### [Fórmula 2]

20 [donde R³ y R⁴ tienen los mismos significados que los descritos en la reivindicación 1] con un derivado de 3-butinilamina [III] representado por la siguiente fórmula general [III]:

- 25 [donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tienen los mismos significados que los descritos en la reivindicación 1] en presencia de una base.
  - 8. Un agente pesticida que comprende, como principio(s) activo(s), uno o dos o más de los derivados de 4-(3-butinil) aminopirimidina representados por la fórmula general [I] de acuerdo con la reivindicación 1.