

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 497 501**

51 Int. Cl.:

C07D 493/08 (2006.01)

A01N 43/08 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.08.2008** **E 08801523 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **18.06.2014** **EP 2185564**

54 Título: **Compuestos ciclopentanodiónicos herbicidamente activos y sus derivados**

30 Prioridad:

08.08.2007 GB 0715454

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

23.09.2014

73 Titular/es:

**SYNGENTA LIMITED (100.0%)
European Regional Centre Priestley Road Surrey
Research Park
Guildford Surrey GU2 7YH, GB**

72 Inventor/es:

**TYTE, MELLONEY;
MATHEWS, CHRISTOPHER JOHN;
HALL, GAVIN JOHN;
WHITTINGHAM, WILLIAM GUY;
WAILES, JEFFREY STEVEN;
SCUTT, JAMES NICHOLAS;
JEANMART, STEPHANE ANDRÉ MARIE y
VINER, RUSSELL COLIN**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 497 501 T3

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

DESCRIPCIÓN

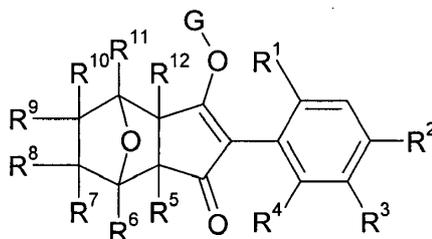
Compuestos ciclopentanodiónicos herbicidamente activos y sus derivados

La presente invención se refiere a nuevos compuestos ciclopentanodiónicos herbicidamente activos, y a sus derivados, a procedimientos para su preparación, a composiciones que comprenden esos compuestos, y a su uso para controlar las malas hierbas, especialmente en cultivos de plantas útiles, o para inhibir el crecimiento indeseado de las plantas.

Los compuestos ciclopentanodiónicos que tienen acción herbicida se describen, por ejemplo, en los documentos WO 01/74770 y WO 96/03366. El documento WO99/48869A1 (Bayer AG) describe cetoenoles cíclicos sustituidos con arilfenilo, y su uso como agentes y herbicidas para el control de plagas. El documento US2005/0164883A1 (Maetzke et al.) describe ciertos heterociclos o carbociclos, sustituidos con ciertos grupos fenílicos, y que tienen propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento. El documento WO2005/123667A1 (Syngenta Participations AG) describe derivados benzoílicos que tienen propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento, y que tienen un doble enlace en la posición 6,7 de, por ejemplo, una biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona. El documento WO2004/058712A2 (Syngenta Participations AG) describe derivados nicotinoílicos que tienen propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento, y que tienen un doble enlace en la posición 6,7 de, por ejemplo, una biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

Se han encontrado ahora nuevos compuestos ciclopentanodiónicos, y sus derivados, que tienen propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento.

La presente invención se refiere en consecuencia a compuestos de fórmula I



(I),

en la que

G es hidrógeno o un metal alcalino, metal alcalino-térreo, sulfonio, amonio o un grupo protector, en el que el grupo protector es como se define aquí,

R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, etinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂,

R², R³ y R⁴ son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, etinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂,

R⁵ y R¹² son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, halógeno o alcoxi C₁-C₆-carbonilo, o

R⁵ y R¹², unidos juntos, forman un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno o de azufre, y

y en la que

R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, formilo, ciano o nitro, o

R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, un grupo COR¹³, CO₂R¹⁴ o CONR¹⁵R¹⁶, CR¹⁷=NOR¹⁸, CR¹⁹=NNR²⁰R²¹, NHR²², NR²²R²³ o OR²⁴, en los que

R¹³ es alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

R¹⁴ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o es heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

R¹⁵ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

5 R¹⁶ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o amino, o

R¹⁵ y R¹⁶ se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, y

10 R¹⁷ y R¹⁹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃ o cicloalquilo de C₃-C₆,

R¹⁸, R²⁰ y R²¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo o heteroarilo, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o aminocarbonilo, y

15 R²² es alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilcarbonilo, fenoxicarbonilo, fenilaminocarbonilo, feniltiocarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilcarbonilo, heteroariloxicarbonilo, heteroarilaminocarbonilo, heteroariltiocarbonilo o heteroarilsulfonilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

20 R²³ es alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o R²² y R²³ se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y R²⁴ es alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o aminocarbonilo;

y en la que

R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, formilo, amino, ciano o nitro, o

30 R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-tio-alquilo de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinil-alquilo de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinil-alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₄-C₇, tri(alquil C₁-C₆)sililo, arilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

35 R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, un grupo COR^{13A}, CO₂R^{14A} o CONR^{15A}R^{16A}, CR^{17A}=NOR^{18A}, CR^{19A}=NNR^{20A}R^{21A}, NR^{22A}R^{23A} o OR^{24A}, o

R⁷ y R⁸, o R⁹ y R¹⁰, forman juntos una unidad =O, o forman una unidad =CR²⁵R²⁶, o forman una unidad =NR²⁷,

40 o cualesquiera dos de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ forman un anillo de 3 a 8 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S y N y opcionalmente sustituido con: alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, haloalquilo de C₁-C₃, halógeno, fenilo; fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, halógeno, ciano o con nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, halógeno, ciano o con nitro,

45 o R⁷ y R¹⁰ forman juntos un enlace;

y en la que

R^{13A} es alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

50 R^{14A} es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o es heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

R^{15A} es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

5 R^{16A} es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₅-C₇, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o amino, o

R^{15A} y R^{16A} se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, y

10 R^{17A} y R^{19A} son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃ o cicloalquilo de C₃-C₆,

R^{18A}, R^{20A} y R^{21A} son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo o heteroarilo, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

15 R^{22A} y R^{23A} son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilo o heteroarilo, o R^{22A} y R^{23A} se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

20 R^{24A} es alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos;

y en la que

25 R²⁵ y R²⁶ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano o nitro, o

R²⁵ y R²⁶ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-fenil-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-fenil-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-heteroaril-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-heteroaril-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo, heteroarilo, cicloalquilo de C₃-C₈ o heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

30 R²⁵ y R²⁶ se unen juntos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S o N y opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₂ o alcoxi de C₁-C₂, y R²⁷ es nitro o ciano, o

35 R²⁷ es alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alcoxi de C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, alquino C₃-C₆-oxi, fenoxi, fenilamino, *N*-fenil-*N*-alquil C₁-C₆-amino, *N*-fenil-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-amino, heteroariloxi, heteroarilamino, *N*-heteroaril-*N*-alquil C₁-C₆-amino o *N*-heteroaril-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-amino, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos.

40 En las definiciones de los sustituyentes de los compuestos de la fórmula I, cada resto de alquilo, ya sea solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi, alquiltio, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena lineal o ramificada, y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo o neopentilo. Los grupos alquilo son adecuadamente grupos alquilo de C₁-C₆, pero son preferiblemente grupos alquilo de C₁-C₄ o alquilo de C₁-C₃, y, más preferiblemente, grupos alquilo de C₁-C₂.

45 En los compuestos de fórmula I, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto de alquilo (solo o como parte de un grupo más grande tal como alcoxi, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) se seleccionan de uno o más halógeno, nitro, ciano, cicloalquilo de C₃₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), cicloalqueno de C₅₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁₋₁₀, alcoxi C₁₋₁₀-alcoxi (C₁₋₁₀), tri-alquil (C₁₋₄)-silil-alcoxi (C₁₋₆), alcoxi C₁₋₆-carbonil-alcoxi (C₁₋₁₀), haloalcoxi de C₁₋₁₀, aril-alcoxi (C₁₋₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃₋₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), alqueno C₃₋₁₀-oxi, alquino C₃₋₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁₋₁₀-tio, haloalquil C₁₋₁₀-tio, arilalquil (C₁₋₄)-tio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃₋₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), tri-alquil (C₁₋₄)-silil-alquil (C₁₋₆)-tio, ariltio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, haloalquil C₁₋₆-sulfinilo, arilsulfonilo (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido), trialquil (C₁₋₄)-sililo, arildi-alquil

(C₁₋₄)-sililo, alquil (C₁₋₄)-diarilsililo, triarilsililo, aril-alquil (C₁₋₄)-tio-alquilo (C₁₋₄), ariloxi-alquilo (C₁₋₄), formilo, alquil C₁₋₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁₋₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁₋₆)aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁₋₃)-*N*-(alcoxi C₁₋₃)aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-carboniloxi, arilcarboniloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil (C₁₋₆)-aminocarboniloxi, alquil C₁₋₆-imino-oxi, alquenil C₃₋₆-oxi-imino, ariloxiimino, arilo (él mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterociclioxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), amino, alquil C₁₋₆-amino, di-alquil (C₁₋₆)amino, alquil C₁₋₆-carbonilamino, *N*-alquil (C₁₋₆)-carbonil-*N*-alquil (C₁₋₆)-amino, alquenil C₂₋₆-carbonilo, alquinil C₂₋₆-carbonilo, alquenil C₃₋₆-oxicarbonilo, alquinil C₃₋₆-oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido). En los sustituyentes opcionales anteriores, "arilo" significa fenilo.

Los restos de alquenilo y de alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alquenilo, cuando sea apropiado, pueden ser de la configuración (*E*) o (*Z*). Los ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los restos de alquenilo y de alquinilo pueden contener uno o más dobles y/o triples enlaces en cualquier combinación. Se entiende que alenilo y alquilalquenilo se incluyen en estos términos. Se ha de entender que las unidades de alquenilo formadas por R⁷ junto con R⁸ están directamente unidas al anillo ciclohexánico en puente mediante un doble enlace.

En los compuestos de fórmula I, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo se seleccionan de aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquílico.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más de los mismos o diferentes átomos de halógeno, y son, por ejemplo, CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, FCH₂, ClCH₂, BrCH₂, CH₃CHF, (CH₃)₂CF, CF₃CH₂ o CHF₂CH₂.

En el contexto de la presente memoria descriptiva, el término "arilo" se refiere a sistemas anulares que pueden ser mono-, bi- o tricíclicos. Ejemplos de tales anillos incluyen fenilo, naftilo, antraceno, indenilo o fenantrenilo. Un grupo arilo preferido es fenilo.

En los compuestos de fórmula I, "arilo" significa fenilo.

En los compuestos de fórmula I, el término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o en dos anillos condensados. Preferiblemente, los anillos individuales contendrán hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos, que se escogerán preferiblemente de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo y indolizínilo.

Ejemplos preferidos de radicales heteroaromáticos incluyen piridilo, pirimidinilo, triazinilo, tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo y tiazolilo.

Otro grupo de heteroarilos preferidos comprende furilo, tienilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo.

En los compuestos de fórmula I, el término "heterociclilo" se refiere a un sistema anular no aromático monocíclico o bicíclico que contiene hasta 7 átomos que incluyen uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N. Ejemplos de tales anillos incluyen 1,3-dioxolano, oxetano, tetrahidrofurano, morfolina, tiomorfolina y piperazina.

Cicloalquilo incluye preferiblemente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Cicloalquilalquilo es preferiblemente ciclopropilmetilo. Cicloalquenilo incluye preferiblemente ciclopentenilo y ciclohexenilo.

En los compuestos de fórmula I, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo se seleccionan de alquilo de C₁₋₃ así como aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquílico.

Los anillos carbocíclicos, tales como aquellos formados por R⁷ junto con R⁸, incluyen arilo, cicloalquilo o grupos carbocíclicos, y grupos cicloalquenilo.

En los compuestos de fórmula I, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclos se seleccionan, independientemente, de halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, alquilo de C₁₋₆,

haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), alqueno de C₂₋₆, haloalqueno de C₂₋₆, alquino de C₂₋₆, cicloalquilo de C₃₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), cicloalqueno de C₅₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁₋₁₀, alcoxi, alcoxi C₁₋₁₀-alcoxi (C₁₋₁₀), tri-
 5 arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁₋₆), cicloalquil C₃₋₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), alquenoil C₃₋₁₀-oxi, alquinoil C₃₋₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁₋₁₀-tio, haloalquil C₁₋₁₀-tio, aril-alquil (C₁₋₄)-tio, cicloalquil C₃₋₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), triarquil (C₁₋₄)-silil-alquil (C₁₋₆)-tio, ariltio, alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, arilsulfonilo, tri-alquil (C₁₋₄)-sililo, arildi-alquil (C₁₋₄)-sililo, alquil (C₁₋₄)-diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁₋₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁₋₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁₋₆)-aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁₋₃)-*N*-(alcoxi C₁₋₃)aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil (C₁₋₆)-amino-carboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heterociclilo (él mismo
 10 opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heterociclioxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), amino, alquil C₁₋₆-amino, di-alquil (C₁₋₆)-amino, alquil C₁₋₆-carbonilamino, *N*-alquil (C₁₋₆)-carbonil-*N*-alquil (C₁₋₆)-amino, y arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁₋₆); o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁₋₆. En los sustituyentes opcionales anteriores, "arilo" significa fenilo.

Para grupos heterociclilo sustituidos, uno o más sustituyentes se seleccionan independientemente de halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-tio, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, nitro y ciano. Se entenderá que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos en los que los grupos dialquilo junto con el átomo de N al que están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que pueden contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo (C₁₋₆) seleccionados independientemente. Cuando los anillos heterocíclicos se forman uniendo dos grupos en un átomo de N, los anillos resultantes son adecuadamente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina, cada uno de los cuales puede estar sustituido con uno o dos grupos alquilo (C₁₋₆) seleccionados independientemente.
 25
 30

La invención también se refiere a las sales que los compuestos de fórmula I son capaces de formar con bases de aminas, de metales alcalinos y de metales alcalino-térreos, o bases de amonio cuaternario.

Entre los hidróxidos de metales alcalinos y de metales alcalino-térreos como formadores de sales, se debería hacer mención especial a los hidróxidos de litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero especialmente los hidróxidos de sodio y potasio. Los compuestos de fórmula I según la invención también incluyen hidratos que se pueden formar durante la formación de sales.
 35

Ejemplos de aminas adecuadas para la formación de sales de amonio incluyen amoniaco así como alquil C₁-C₁₈-aminas primarias, secundarias y terciarias, hidroxialquil C₁-C₄-aminas y alcoxi C₂-C₄-alquilaminas, por ejemplo metilamina, etilamina, *n*-propilamina, isopropilamina, los cuatro isómeros de butilamina, *n*-amilamina, isoamilamina, hexilamina, heptilamina, octilamina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metiletilamina, metilisopropilamina, metilhexilamina, metilnonilamina, metilpentadecilamina, metilheptadecilamina, etilbutilamina, etilheptilamina, etilheptilamina, hexilheptilamina, hexilheptilamina, dietilamina, di-*n*-propilamina, diisopropilamina, di-*n*-butilamina, di-*n*-amilamina, diisoamilamina, dihexilamina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, *n*-propanolamina, isopropanolamina, *N,N*-dietanolamina, *N*-etilpropanolamina, *N*-butiletanolamina, alilamina, *n*-but-2-enilamina, *n*-pent-2-enilamina, 2,3-dimetilbut-2-enilamina, dibut-2-enilamina, *n*-hex-2-enilamina, propilendiamina, trimetilamina, trietilamina, tri-*n*-propilamina, triisopropilamina, tri-*n*-butilamina, triisobutilamina, tri-*sec*-butilamina, tri-*n*-amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas, por ejemplo piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias, por ejemplo anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, *o*-, *m*- y *p*-toluidinas, fenilendiaminas, bencidinas, naftilaminas y *o*-, *m*- y *p*-cloroanilinas; pero especialmente trietilamina, isopropilamina y diisopropilamina.
 40
 45
 50

Las base de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales corresponde, por ejemplo, a la fórmula [N(R_a R_b R_c R_d)]OH en la que R_a, R_b, R_c y R_d son, cada uno independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₄. Otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones se pueden obtener, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio aniónico.
 55

Los grupos protectores G se seleccionan para permitir su eliminación mediante uno o una combinación de procedimientos bioquímicos, químicos o físicos para dar compuestos de fórmula I en la que G es H antes, durante o después de la aplicación al área o plantas tratadas. Los ejemplos de estos procedimientos incluyen escisión enzimática, hidrólisis química, y fotólisis. Los compuestos que poseen tales grupos G pueden ofrecer ciertas ventajas, tales como una penetración mejorada de la cutícula de las plantas tratadas, mayor tolerancia de los
 60

cultivos, compatibilidad o estabilidad mejorada en mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas, o lixiviación reducida en suelos.

En los compuestos de fórmula I, R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, formilo, ciano o nitro, o

5 R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, un grupo COR¹³, CO₂R¹⁴ o CONR¹⁵R¹⁶, CR¹⁷=NOR¹⁸, CR¹⁹=NNR²⁰R²¹ NHR²², NR²²R²³ o OR²⁴, en los que

10 R¹³ es alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

R¹⁴ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o es heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

15 R¹⁵ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

20 R¹⁶ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalqueno de C₃-C₇, alquilsulfonilo de C₁-C₆, fenilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o amino, o

R¹⁵ y R¹⁶ se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, y

25 R¹⁷ y R¹⁹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃ o cicloalquilo de C₃-C₆,

R¹⁸, R²⁰ y R²¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo o heteroarilo, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o aminocarbonilo, y

30 R²² es alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilcarbonilo, fenoxicarbonilo, fenilaminocarbonilo, feniltiocarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilcarbonilo, heteroariloxicarbonilo, heteroarilaminocarbonilo, heteroariltiocarbonilo o heteroarilsulfonilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

35 R²³ es alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o R²² y R²³ se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y R²⁴ es

40 alqueno de C₃-C₆, alquino de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₁-C₆-aminocarbonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o aminocarbonilo.

Más preferiblemente, R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C₁-C₆ opcionalmente sustituido o un grupo COR¹³, CO₂R¹⁴ o CONR¹⁵R¹⁶, CR¹⁷=NOR¹⁸ o CR¹⁹=NNR²⁰R²¹, en los que

R¹³, R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ son alquilo de C₁-C₆,

45 R¹⁷ y R¹⁹ son hidrógeno o alquilo de C₁-C₃,

R¹⁸ es alquilo de C₁-C₃, y

R²⁰ y R²¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo de C₁-C₃.

En particular, R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo o metilo sustituido con alcoxi de C₁-C₃.

50 Preferiblemente, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, formilo, amino, ciano o nitro, o

5 R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -tio-alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfinil-alquilo de C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfonil-alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , cicloalquenilo de C_4-C_7 , tri(alquil C_1-C_6)sililo, arilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, un grupo COR^{13A} , CO_2R^{14A} o $CO_2CONR^{15A}R^{16A}$, $CR^{17A}=NOR^{18A}$, $CR^{19A}=NNR^{20A}R^{21A}$, $NR^{22A}R^{23A}$ o OR^{24A} , en los que

10 R^{13A} es alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , cicloalquenilo de C_5-C_7 , fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

R^{14A} es hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_3-C_6 , alquinilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , cicloalquenilo de C_5-C_7 , fenilo, heteroarilo o es heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

15 R^{15A} es hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_3-C_6 , alquinilo de C_3-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalcoxi de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , cicloalquenilo de C_5-C_7 , fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

20 R^{16A} es hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_3-C_6 , alquinilo de C_3-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalcoxi de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , cicloalquenilo de C_5-C_7 , alquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -amino, dialquil C_1-C_6 -amino, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o amino, o

R^{15A} y R^{16A} se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, y

R^{17A} y R^{19A} son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C_1-C_3 o cicloalquilo de C_3-C_6 ,

25 R^{18A} , R^{20A} y R^{21A} son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_3-C_6 , alquinilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquil C_1-C_6 -carbonilo, alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alquil C_1-C_6 -tiocarbonilo, alquil C_1-C_6 -aminocarbonilo, dialquil C_1-C_6 -aminocarbonilo, fenilo o heteroarilo, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

30 R^{22A} y R^{23A} son, independientemente entre sí, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_3-C_6 , alquinilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquil C_1-C_6 -carbonilo, alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alquil C_1-C_6 -tiocarbonilo, alquil C_1-C_6 -aminocarbonilo, dialquil C_1-C_6 -aminocarbonilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, fenilo o heteroarilo, o R^{22A} y R^{23A} se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

35 R^{24A} es alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_3-C_6 , alquinilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquil C_1-C_6 -carbonilo, alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alquil C_1-C_6 -tiocarbonilo, alquil C_1-C_6 -aminocarbonilo, dialquil C_1-C_6 -aminocarbonilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, tri(alquil C_1-C_6)sililo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos.

Más preferiblemente, R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son hidrógeno.

Se prefiere también que uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} sea metilo o etilo.

40 Se prefiere también que uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} sea un arilo o un heteroarilo opcionalmente sustituido, y más preferiblemente fenilo, naftilo, furilo, tienilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo, opcionalmente sustituido.

En particular, uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} es piridilo o piridilo sustituido con trifluorometilo o halógeno.

Se prefiere también que R^7 y R^{10} formen un enlace.

45 Preferiblemente, R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, ciano, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio-alquilo de C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfinil-alquilo de C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfonil-alquilo de C_1-C_6 , heterociclilo de 3 a 7 miembros, fenilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o $CR^{17A}=NOR^{18A}$, en el que

R^{17A} es hidrógeno o alquilo de C_1-C_3 , y

R^{18A} es alquilo de C_1-C_3 .

En otro grupo preferido de compuestos de fórmula I, R^7 y R^8 , o R^9 y R^{10} , forman juntos una unidad =O, o forman una unidad =CR²⁵R²⁶, o forman una unidad =NR²⁷,

5 o dos cualquiera de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} forman un anillo de 3 a 8 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S y N y opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfino, alquil C₁-C₃-sulfonilo, haloalquilo de C₁-C₃, halógeno, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfino, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₁-C₆-aminocarbonilo, halógeno, ciano o con nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfino, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, halógeno, ciano o con nitro, en los que

R^{25} y R^{26} son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano o nitro, o

15 R^{25} y R^{26} son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-fenil-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-fenilalquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-heteroaril-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-heteroaril-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo, heteroarilo, cicloalquilo de C₃-C₈ o heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

R^{25} y R^{26} se unen juntos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S o N y opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₂ o alcoxi de C₁-C₂,

R^{27} es nitro o ciano, o

20 R^{27} es alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₁-C₆-amino, alcoxi de C₁-C₆, alquenil C₃-C₆-oxi, alquínil C₃-C₆-oxi, fenoxi, fenilamino, *N*-fenil-*N*-alquil C₁-C₆-amino, *N*-fenil-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-amino, heteroariloxi, heteroarilamino, *N*-heteroaril-*N*-alquil C₁-C₆-amino o *N*-heteroaril-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-amino, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos;

en el que, más preferiblemente, R^7 y R^8 , o R^9 y R^{10} , forman juntos una unidad =O o =NR²⁷,

25 en el que R^{27} es alcoxi de C₁-3 o alquenil C₂-C₃-oxi.

Más preferiblemente, R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, ciano, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, heterociclilo de 3 a 7 miembros, fenilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

30 En particular, R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, o fenilo opcionalmente sustituido.

En particular, uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} es heteroarilo opcionalmente sustituido, preferiblemente furilo, tienilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo opcionalmente sustituido,

y más preferiblemente piridilo sustituido una o dos veces con trifluorometilo o halógeno.

35 En otro grupo de compuestos preferidos de fórmula I, R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno.

40 En otro grupo de compuestos preferidos de fórmula I, R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno, y R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, ciano, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, heterociclilo de 3 a 7 miembros, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, preferiblemente heteroarilo opcionalmente sustituido, y en particular piridilo sustituido una o dos veces con trifluorometilo o halógeno.

En otro grupo de compuestos preferidos de fórmula I, R^5 y R^{12} son, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo de C₁-C₃, en el que se prefiere más hidrógeno.

En otro grupo de compuestos preferidos de fórmula I, R^1 es metilo, etilo, vinilo, etinilo, ciclopropilo, difluorometoxi, trifluorometoxi o alcoxi de C₁-C₂, y

45 R^2 , R^3 y R^4 son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, vinilo o etinilo. Preferiblemente, en este grupo, R^1 es etilo y R^2 , R^3 y R^4 son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo o etilo.

Preferiblemente, en este grupo, R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno.

50 En los compuestos de fórmula I, el grupo protector G se selecciona de los grupos fenil-alquilo de C₁-C₈ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfino, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de

C₁-C₈ (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquenilo de C₃-C₈, haloalquenilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g y CH₂-X^f-R^h;

5 en los que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son, independientemente entre sí, oxígeno o azufre; y en los que

R^a es H, alquilo de C₁-C₁₈, alquenilo de C₂-C₁₈, alquinilo de C₂-C₁₈, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxialquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquilidén C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo de C₁-C₅, N-alquil C₁-C₅-carbonil-N-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅, (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

R^b es alquilo de C₁-C₁₈, alquenilo de C₃-C₁₈, alquinilo de C₃-C₁₈, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquilo C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquilidén C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo de C₁-C₅, N-alquil C₁-C₅-carbonil-N-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅, (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

R^c y R^d son, cada uno independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₁₀, alquenilo de C₃-C₁₀, alquinilo de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquilidén C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo de C₁-C₅, N-alquil C₁-C₅-carbonil-N-alquil C₂-C₅-aminoalquilo, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅, (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, difenilamino o difenilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, difenilamino o difenilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, o cicloalquil C₃-C₇-amino, di-cicloalquil C₃-C₇-amino o cicloalcoxi de C₃-C₇;

o R^c y R^d se pueden unir juntos para formar un anillo de 3 a 7 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O o S; y

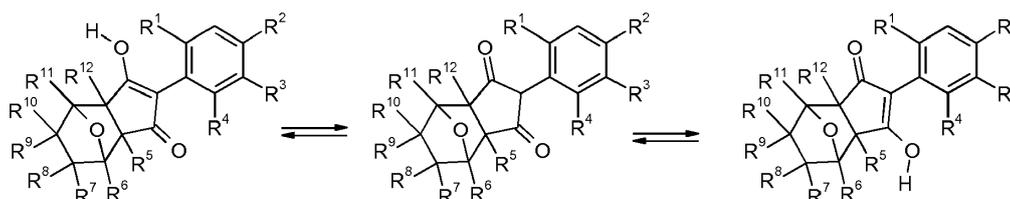
R^e es alquilo de C₁-C₁₀, alquenilo de C₂-C₁₀, alquinilo de C₂-C₁₀, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil

Particularmente, el grupo protector G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, y el significado de X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se definen antes.

Se prefiere que G sea hidrógeno, un metal alcalino o un metal alcalino-térreo, en el que se prefiere especialmente hidrógeno.

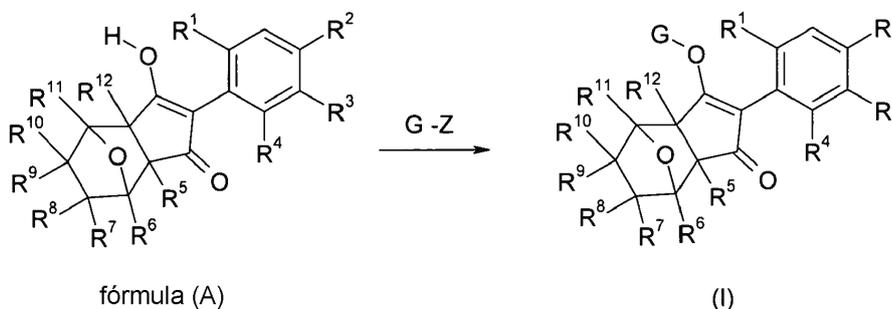
5 Se debería entender que en aquellos compuestos de fórmula I en la que G es un metal, catión amonio (tal como NH_4^+ ; $N(\text{alquilo})_4^+$) o sulfonio (tal como $S(\text{alquilo})_3^+$), la carga negativa correspondiente está muy deslocalizada a lo largo de la unidad $O-C=C-C=O$.

10 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes formas isómeras. Cuando G es hidrógeno, por ejemplo, los compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes formas tautómeras:

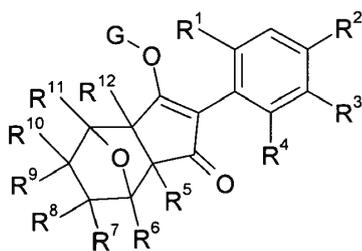


Esta invención cubre todos estos isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones. También, cuando los sustituyentes contienen dobles enlaces, pueden existir los isómeros *cis* y *trans*. Estos isómeros están, también, dentro del alcance de los compuestos reivindicados de la fórmula I.

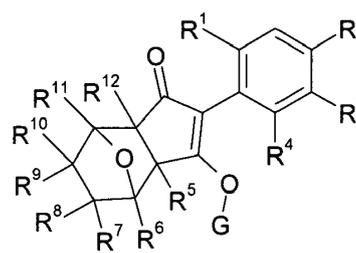
15 Un compuesto de fórmula I en la que G es fenil-alquilo de C_1-C_8 (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sufinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C_1-C_8 (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sufinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alqueno de C_3-C_8 , haloalqueno de C_3-C_8 , alquinilo de C_3-C_8 , $C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$, $C(X^d)-N(R^c)-R^d$, $-SO_2-R^e$, $-P(X^e)(R^f)-R^g$ o $CH_2-X^f-R^h$, en los que X^a , X^b , X^c , X^d , X^e , X^f , R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g y R^h son como se definen antes, se puede preparar
 20 tratando un compuesto de fórmula (A), que es un compuesto de fórmula I en la que G es H, con un reactivo G-Z, en el que G-Z es un ganete alquilante tal como un haluro de alquilo (la definición de haluros de alquilo incluye haluros de alquilo de C_1-C_8 sencillos tales como yoduro de metilo y yoduro de etilo, haluros de alquilo sustituidos tales como
 25 fenil-alquilo de C_1-C_6 , éteres de clorometil-alquilo, $Cl-CH_2-X^f-R^h$, en el que X^f es oxígeno, y sulfuros de clorometil-alquilo $Cl-CH_2-X^f-R^h$, en el que X^f es azufre), un sulfonato de alquilo C_1-C_8 , o un sulfato de di-alquilo de C_1-C_8 , o con un haluro de alqueno de C_3-C_8 , o con un haluro de alquinilo de C_3-C_8 , o con un agente acilante tal como un ácido carboxílico, $HO-C(X^a)R^a$, en el que X^a es oxígeno, un cloruro de ácido, $Cl-C(X^a)R^a$, en el que X^a es oxígeno, o anhídrido de ácido, $[R^aC(X^a)]_2O$, en el que X^a es oxígeno, o un isocianato, $R^cN=C=O$, o un cloruro de carbamoilo, $Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d$ (en el que X^d es oxígeno y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloruro de tiocarbamoilo $Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d$ (en el que X^d es azufre y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno) o un cloroformiato, $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$, (en el que X^b y X^c son oxígeno), o un clorotioformiato $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$ (en el que X^b es oxígeno y X^c es azufre), o un clorditioformiato $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$, (en el que X^b y X^c son azufre), o un isotiocianato, $R^cN=C=S$, o por tratamiento secuencial con disulfuro de carbono y un agente alquilante, o con un agente fosforilante
 35 tal como un cloruro de fosforilo, $Cl-P(X^e)(R^f)-R^g$, o con un agente sulfonilante tal como un cloruro de sulfonilo $Cl-SO_2-R^e$, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de base.



40 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes R^1 a R^{12} , y del grupo G, se pueden formar compuestos isómeros de fórmula I. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (A) en la que R^5 y R^{12} son diferentes puede dar lugar a un compuesto de fórmula (1 a) o a un compuesto de fórmula (1 b), o a una mezcla de compuestos de fórmula (1 a) y fórmula (1 b).



fórmula (la)



fórmula (lb)

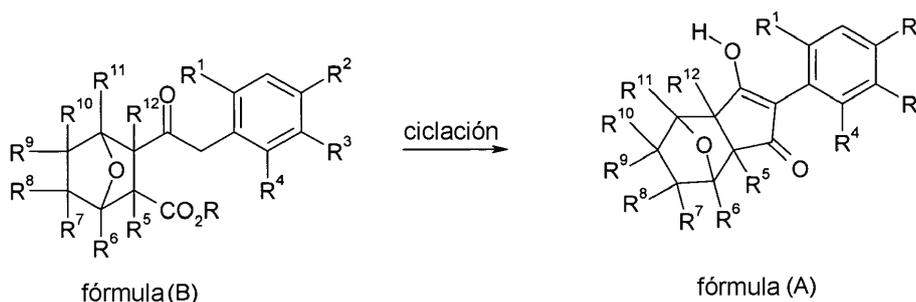
La O-acilación de 1,3-dionas cíclicas es conocida; los métodos adecuados se describen, por ejemplo por T. Wheeler, documento US4436666. Procedimientos alternativos han sido publicados por M. Pizzorno y S. Albonico, Chem. Ind. (Londres), (1972), 425; H. Born *et al.*, J. Chem. Soc., (1953), 1779; M. G. Constantino *et al.*, Synth. Commun., (1992), 22 (19), 2859; Y. Tian *et al.*, Synth. Commun., (1997), 27 (9), 1577; S. Chandra Roy *et al.*, Chem. Letters, (2006), 35 (1), 16; P. K. Zubaidha *et al.*, Tetrahedron Lett., (2004), 45, 7187.

La O-acilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar por procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, por R. Haines, documento US4175135, y por T. Wheeler, documentos US4422870, US4659372 y US4436666. Típicamente, las dionas de fórmula (A) se pueden tratar con un agente acilante, en presencia de al menos un equivalente de una base adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado. La base puede ser inorgánica, tal como un carbonato o hidróxido de un metal alcalino, o un hidruro metálico, o una base orgánica tal como una amina terciaria o un alcóxido metálico. Ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, hidróxido de sodio o potasio, hidruro de sodio, y las bases orgánicas adecuadas incluyen trietilaminas, tales como trimetilamina y trietilamina, piridinas u otras bases amínicas tales como 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los disolventes adecuados para esta reacción se seleccionan de forma que sean compatibles con los reactivos, e incluyen éteres tales como tetrahydrofurano y 1,2-dimetoxietano, y disolventes halogenados tales como diclorometano y cloroformo. Se pueden emplear ciertas bases, tales como piridina y trietilamina, de forma satisfactoria tanto como bases como disolventes. Para los casos en los que el agente acilante es un ácido carboxílico, la acilación se efectúa preferiblemente en presencia de un agente de acoplamiento, tal como yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y *N,N'*-carbodiimidazol, y opcionalmente una base tal como trietilamina o piridina en un disolvente adecuado tal como tetrahydrofurano, diclorometano o acetonitrilo. Procedimientos adecuados se describen, por ejemplo, por W. Zhang y G. Pugh, Tetrahedron Lett., (1999), 40 (43), 7595-7598 y T. Isobe y T. Ishikawa, J. Org. Chem., (1999), 64 (19), 6984.

La fosforilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar utilizando un haluro de fosforilo o haluro de tiosforilo y una base, mediante procedimientos análogos a los descritos por L. Hodakowski, documento US4409153.

La sulfonilación de un compuesto de fórmula (A) se puede lograr usando un haluro de alquilsulfonilo o arilsulfonilo, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de base, por ejemplo mediante el procedimiento de C. Kowalski y K. Fields, J. Org. Chem., (1981), 46, 197.

Un compuesto de fórmula (A) se puede preparar mediante la ciclación de un compuesto de fórmula (B), en la que R es hidrógeno o un grupo alquilo, preferiblemente en presencia de un ácido o una base, y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, mediante métodos análogos a los descritos por T. Wheeler, documento US4209532. Los compuestos de fórmula (B) han sido particularmente diseñados como intermedios en la síntesis de los compuestos de fórmula I. Un compuesto de fórmula (B), en la que R es hidrógeno, se puede ciclar en condiciones ácidas, preferiblemente en presencia de un ácido fuerte tal como ácido sulfúrico, ácido polifosfórico o reactivo de Eaton, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado tal como ácido acético, tolueno o diclorometano.

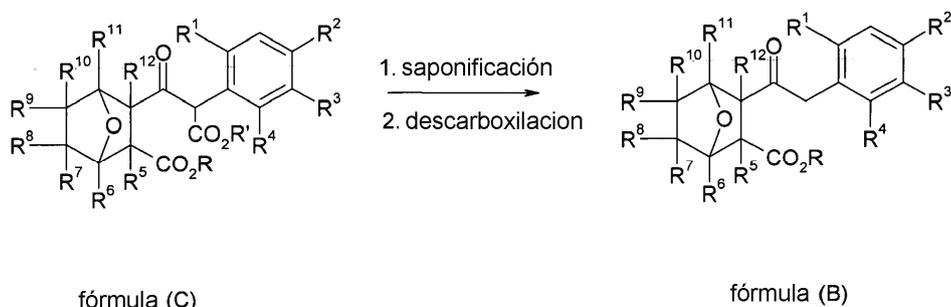


fórmula (B)

fórmula (A)

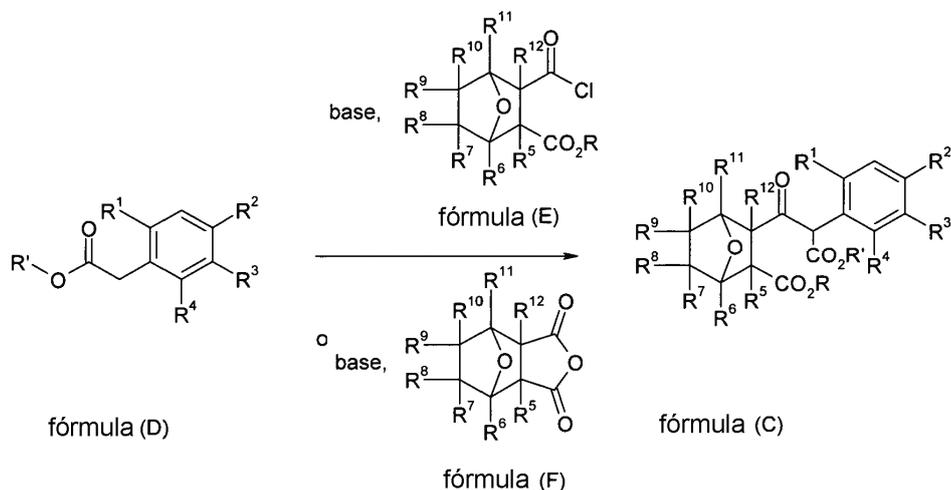
Un compuesto de fórmula (B), en la que R es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), se puede ciclar en condiciones ácidas o básicas, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de una base fuerte tal como *tert*-butóxido de potasio, diisopropilamido de litio o hidruro de sodio, y en un disolvente tal como tetrahidrofurano, tolueno, dimetilsulfóxido o *N,N*-dimetilformamida.

- 5 Un compuesto de fórmula (B), en la que R es H, se puede preparar por saponificación de un compuesto de fórmula (C), en la que R' es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), usando condiciones estándar, seguido de acidificación de la mezcla de reacción para efectuar la descarboxilación, mediante procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, por T. Wheeler, documento US4209532.



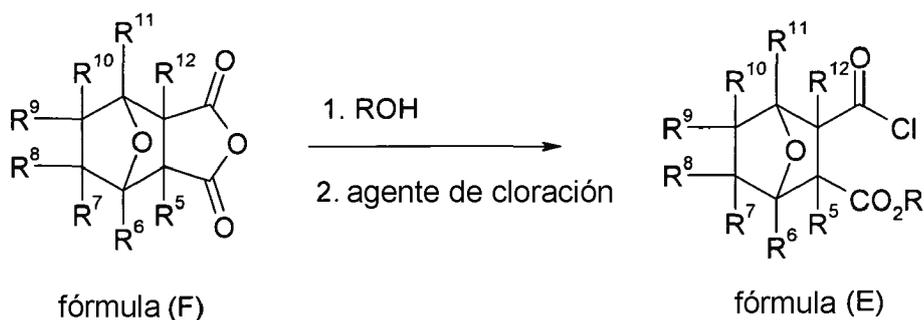
- 10 Un compuesto de fórmula (B), en la que R es H, se puede esterificar a un compuesto de fórmula (B), en la que R es alquilo, en condiciones estándar, por ejemplo calentando con un alcohol alquílico, ROH, en presencia de un catalizador ácido.

- 15 Un compuesto de fórmula (C), en la que R es alquilo, se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (D) con un cloruro de ácido carboxílico adecuado de fórmula (E), en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen *tert*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amido de sodio y diisopropilamido de litio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura entre -80°C y 30°C. Alternativamente, un compuesto de fórmula (C), en la que R es H, se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (D) con una base adecuada (tal como *tert*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amido de sodio y diisopropilamido de litio) en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura adecuada (entre -80°C y 30°C), y haciendo reaccionar el anión resultante con un anhídrido adecuado de fórmula (F):



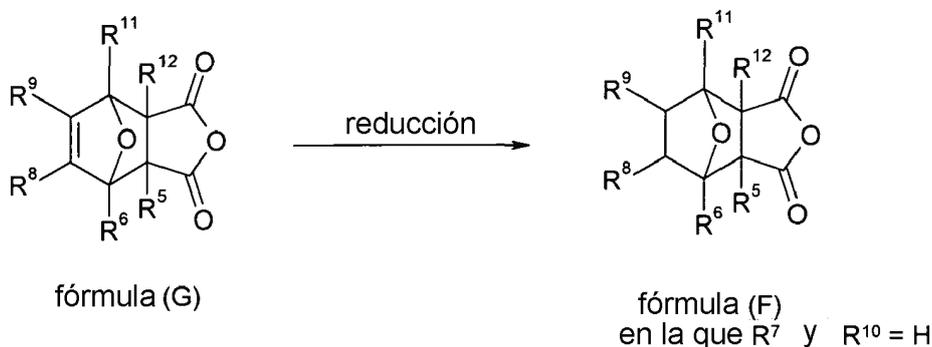
Los compuestos de fórmula (D) son compuestos conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

- 25 Un compuesto de fórmula (E) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (F) mediante tratamiento con un alcohol alquílico, ROH, en presencia de una base, tal como dimetilaminopiridina o un alcóxido de metal alcalino (véanse, por ejemplo, S. Buser and A. Vasella, *Helv. Chim. Acta*, (2005), 88, 3151; M. Hart et al., *Bioorg. Med. Chem. Letters*, (2004), 14, 1969), seguido de tratamiento del ácido resultante con un agente clorante tal como cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo en condiciones conocidas (véase, por ejemplo, C. Santelli-Rouvier, *Tetrahedron Lett.*, 1984, 25, (39), 4371; D. Walba y M. Wand, *Tetrahedron Lett.*, (1982), 23 (48), 4995; J. Cason, *Org. Synth. Coll. Vol. III*, (169), 1955).



Un compuesto de fórmula (F) en la que R^7 y R^{10} son hidrógeno se puede preparar mediante la reducción de un compuesto de fórmula (G) en condiciones conocidas (véanse, por ejemplo, Y. Baba, N. Hirukawa y M. Sodeoka, *Bioorg. Med. Chem.* (2005), 13 (17), 5164, M. Hart et al., *Bioorg. Med. Chem. Letters*, (2004), 14 (18), 1969, Y. Baba, N. Hirukawa, N. Tanohira y M. Sodeoka, *J. Am. Chem. Soc.*, (2003), 125, 9740).

5



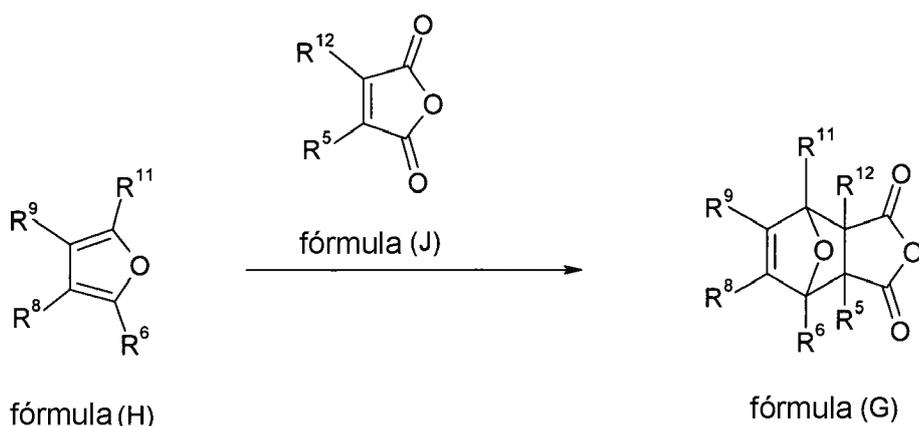
Un compuesto de fórmula (G) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (H) con un anhídrido de fórmula (J), opcionalmente en presencia de un catalizador de ácido de Lewis, y según procedimientos descritos, por ejemplo, por O. Diels y K. Alder, *Liebigs Ann. Chem.*, (1931), 490, 257, K. Potts y E. Walsh, *J. Org. Chem.*, (1984), 49 (21), 4099, J. Jurczak, T. Kozluk, S. Filipek y S. Eugster, *Helv. Chim. Acta*, (1982), 65, 1021, W. Dauben, C. Kessel y K. Takemura, *J. Am. Chem. Soc.*, (1980), 102, 6893, A. Pelter y B. Singaram, *Tetrahedron Lett.*, (1982), 23, 245, M. Lee y C. Herndon, *J. Org. Chem.*, (1978), 43, 518, B. Fisher y J. Hodge, *J. Org. Chem.* (1964), 29, 776, G. D'Alelio, C. Williams y C. Wilson, *J. Org. Chem.*, (1960), 25, 1028, Z. Song, M. Ho y H. Wong, *J. Org. Chem.* (1994), 59 (14), 3917-3926, W. Tochtermann, S. Bruhn y C. Wolff, *Tetrahedron Lett.*, (1994), 35(8), 1165, W. Dauben, J. Lam y Z. Guo, *J. Org. Chem.*, (1996), 61 (14), 4816, M. Sodeoka, Y. Baba, S. Kobayashi y N. Hirukawa, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, (1997), 7 (14), 1833, M. Avalos, R. Babiano, J. Bravo, P. Cintas, J. Jimenez y J. Palacios, *Tetrahedron Lett.*, (1998), 39(50), 9301, J. Auge, R. Gil, S. Kalsey y N. Lubin-Germain, *Synlett*, (2000), 6, 877, I. Hemeon, C. Deamicis, H. Jenkins, P. Scammells y R. Singer, *Synlett*, (2002), 11, 1815, M. Essers, B. Wibbeling y G. Haufe, *Tetrahedron Lett.*, (2001), 42 (32), 5429, P. Vogel et al., *Tetrahedron Asymmetry*, (1996), 7 (11), 3153, Y. Baba, N. Hirukawa, N. Tanohira y M. Sodeoka, *J. Am. Chem. Soc.*, (2003), 125, 9740, L. Ghosez et al., *Tetrahedron Lett.*, (1988), 29 (36), 4573, H. Kotsuki, S. Kitagawa y H. Nishizawa, *J. Org. Chem.*, (1978), 43 (7), 1471, Y. Li et al., *J. Org. Chem.*, (1997), 62 (23), 7926, M. Drew et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, (1985), 1277, R. McDonald y C. Reineke, *J. Org. Chem.*, (1967), 32, 1878, R. Fleming y B. Murray, *J. Org. Chem.*, (1979), 44 (13), 2280, M. Goldstein y G. Thayer Jr. *J. Am. Chem. Soc.*, (1965), 87 (9), 1925, y G. Keglevich et al., *J. Organomet. Chem.*, (1999), 579, 182, y referencias allí.

10

15

20

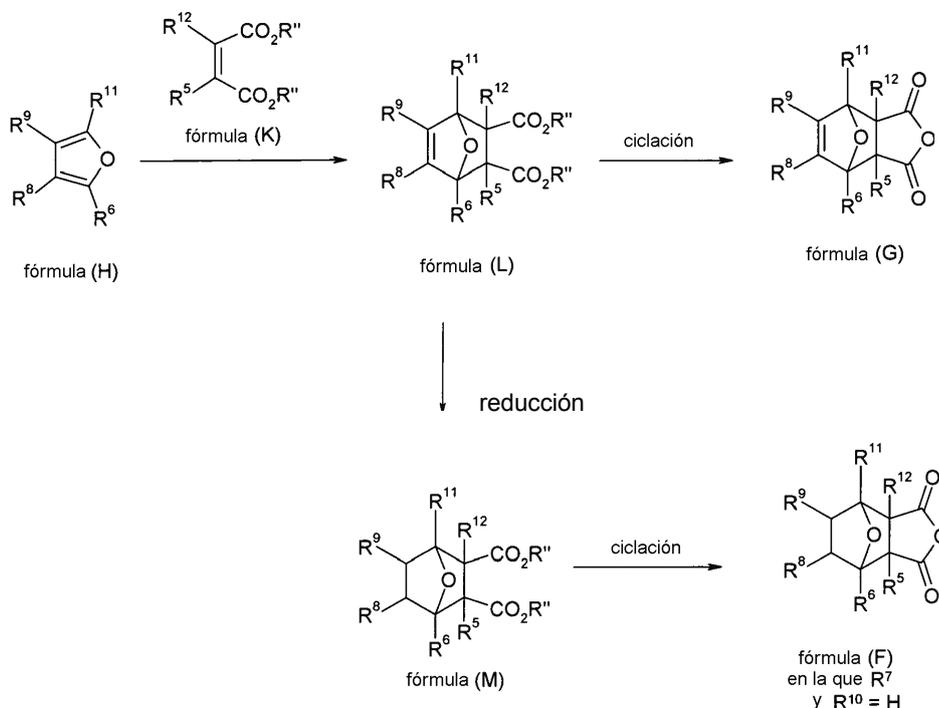
25



Los compuestos de fórmula (H) y fórmula (J) son compuestos conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

Los compuestos de fórmula (G) son alquenos, y como tales sufren reacciones adicionales típicas de alquenos para dar compuestos adicionales de fórmula (F) según procedimientos conocidos. Los ejemplos de tales reacciones incluyen, pero no se restringen a, halogenación, epoxidación, ciclopropanación, dihidroxilación, hidroarilación, hidroviniación e hidratación de alquenos. A su vez, los productos de estas reacciones se pueden transformar en compuestos adicionales de fórmula (F) mediante métodos descritos, por ejemplo, por J. March, *Advanced Organic Chemistry*, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos de fórmula (G) en la que R⁸ o R⁹ son alcoxi de C₁-C₆ son éteres enólicos, y éstos se pueden hidrolizar a la cetona correspondiente usando procedimientos estándar para dar compuestos adicionales de fórmula (F). Ciertos compuestos de fórmula (F), por ejemplo en los que R⁷ es un halógeno, se pueden convertir en compuesto de fórmula (G) mediante métodos conocidos.

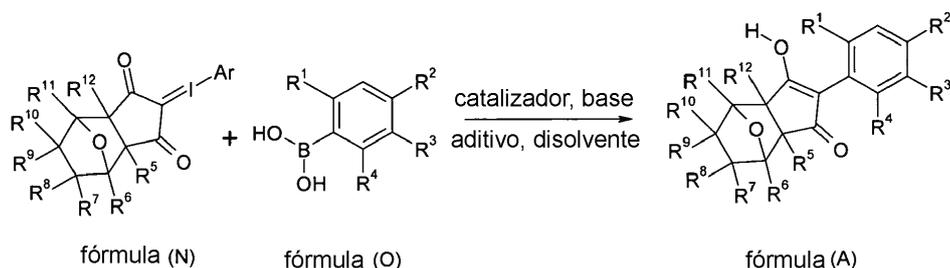
Un compuesto de fórmula (G) también se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (H) con un compuesto de fórmula (K), en la que R¹¹ es hidrógeno o un grupo alquilo, para dar un compuesto de fórmula (L), y ciclando un compuesto de fórmula (L) en condiciones conocidas (véanse, por ejemplo, P. Sprague et al., *J. Med. Chem.*, (1985), 28, 1580, A. Guzaev y M. Manoharan, *J. Am. Chem. Soc.*, (2003), 125, 2380, y A. Marchand y R. Allen, *J. Org. Chem.*, (1975), 40 (17), 2551).



Un compuesto de fórmula (L) también se puede reducir a un compuesto de fórmula (M), y un compuesto de fórmula (M) se puede ciclar a un compuesto de fórmula (F) en la que R⁷ y R¹⁰ son hidrógeno, en condiciones similares a las descritas previamente.

Los compuestos de fórmula (K) son compuestos conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

Compuestos adicionales de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar un iluro de yodonio de fórmula (N), en la que Ar es un grupo fenilo opcionalmente sustituido, y un ácido arilborónico de fórmula (O) en presencia de un catalizador de paladio adecuado, una base y un disolvente adecuado.

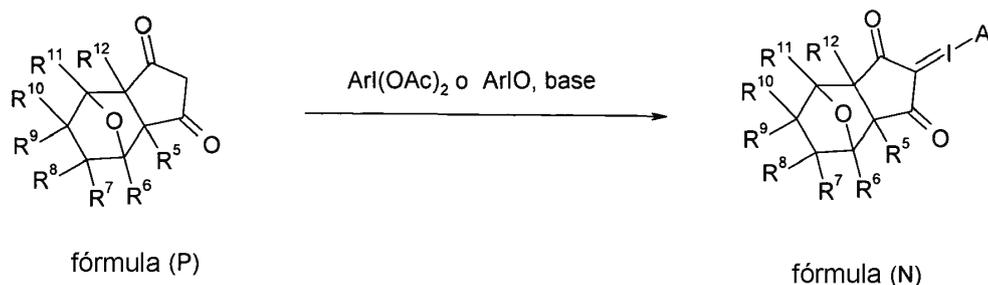


25

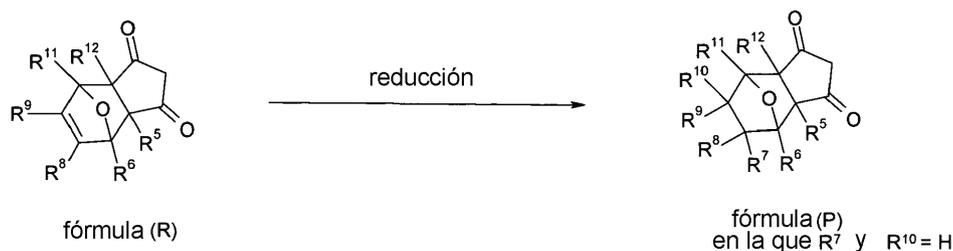
Los catalizadores de paladio adecuados son generalmente complejos de paladio(II) o paladio(0), por ejemplo dihaluros de paladio(II), acetato de paladio(II), sulfato de paladio(II), dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II), dicloruro de bis(triciclopentilfosfina)paladio(II), dicloruro de bis(triciclohexilfosfina)paladio(II), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o tetraquis(trifenilfosfina)-paladio(0). El catalizador de paladio también se puede preparar "in situ" a partir de compuestos de paladio(II) o paladio(0) complejándolos con los ligandos deseados, por ejemplo combinando la sal de paladio(II) a complejar, por ejemplo dicloruro de paladio(II) (PdCl₂) o acetato de paladio(II) (Pd(OAc)₂), junto con el ligando deseado, por ejemplo trifenilfosfina (PPh₃), triciclopentilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo o 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenilo, y el disolvente seleccionado, con un compuesto de fórmula (N), el ácido arilborónico de fórmula (O), y una base. También son adecuados los ligandos bidentados, por ejemplo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno o 1,2-bis(difenilfosfino)etano. Calentando el medio de reacción, el complejo de paladio(II) o complejo de paladio(0) deseado para la reacción de acoplamiento C-C se forma así "in situ", y después inicia la reacción de acoplamiento C-C.

Los catalizadores de paladio se usan en una cantidad de 0,001 a 50% en moles, preferiblemente en una cantidad de 0,1 a 15% en moles, basado en el compuesto de fórmula (N). La reacción también se puede llevar a cabo en presencia de otros aditivos, tales como sales de tetraalquilamonio, por ejemplo bromuro de tetrabutilamonio. Preferiblemente, el catalizador de paladio es acetato de paladio, la base es hidróxido de litio, y el disolvente es 1,2-dimetoxietano acuoso.

Un compuesto de fórmula (N) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (P) mediante tratamiento con un reactivo de yodo hipervalente, tal como (diacetoxi)yodobenceno o un yodosilbenceno, y una base tal como carbonato de sodio acuoso, hidróxido de litio o hidróxido de sodio en un disolvente tal como agua o un alcohol acuoso tal como etanol acuoso, según los procedimientos de K. Schank y C. Lick, Synthesis, (1983), 392, R. M. Moriarty et al., J. Am. Chem. Soc., (1985), 107, 1375, o de Z Yang et al., Org. Lett., 2002, 4 (19), 3333.

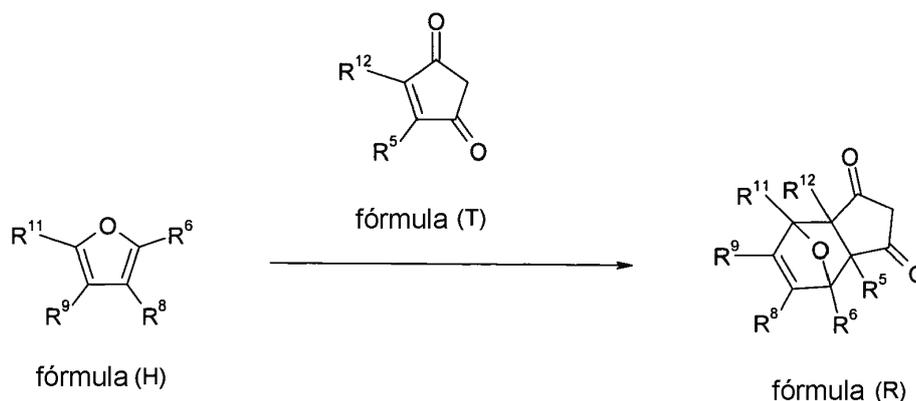


Un compuesto de fórmula (P) en la que R⁷ y R¹⁰ son hidrógeno se puede preparar mediante reducción de un compuesto de fórmula (Q) en condiciones conocidas.



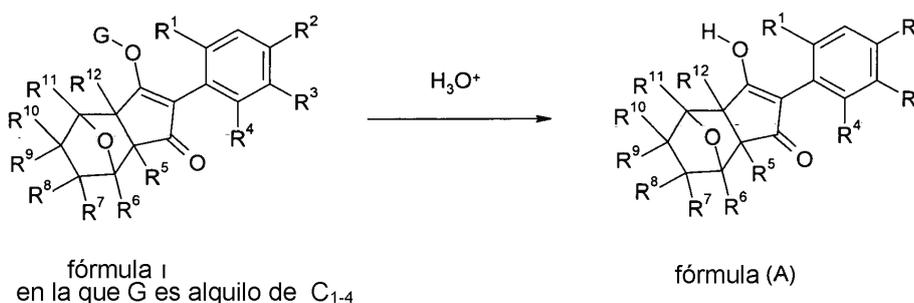
Los compuestos de fórmula (R) son alquenos, y como tales sufren reacciones adicionales típicas de alquenos para dar compuestos adicionales de fórmula (P) según procedimientos conocidos. Los ejemplos de tales reacciones incluyen, pero no se restringen a, halogenación, epoxidación, ciclopropanación, dihidroxilación, hidroarilación, hidroviniación e hidratación de alquenos. A su vez, los productos de estas reacciones se pueden transformar en compuestos adicionales de fórmula (P) mediante métodos descritos, por ejemplo, por J. March, Advanced Organic Chemistry, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos de fórmula (R) en la que R⁸ o R⁹ son alcoxi de C₁-C₆ son éteres enólicos, y éstos se pueden hidrolizar a la cetona correspondiente usando procedimientos estándar. A su vez, la cetona se puede transformar adicionalmente, por ejemplo mediante cetalización, oximación, reducción, y similar, en condiciones conocidas para dar compuestos adicionales de fórmula (P).

Un compuesto de fórmula (R) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (S) con una ciclopentenodiona de fórmula (T), opcionalmente en presencia de un catalizador de ácido de Lewis, según procedimientos descritos, por ejemplo, por B. Zwanenburg et al., Tetrahedron (1989), 45 (22), 7109 y por M. Oda et al., Chem. Lett., (1977), 307.

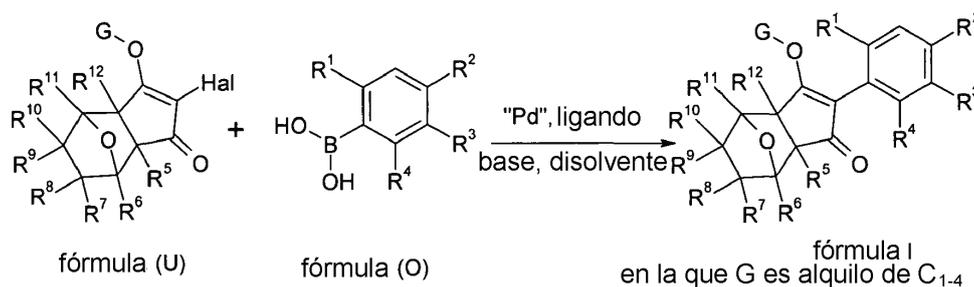


Los compuestos de fórmula (H) y fórmula (T) son compuestos conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

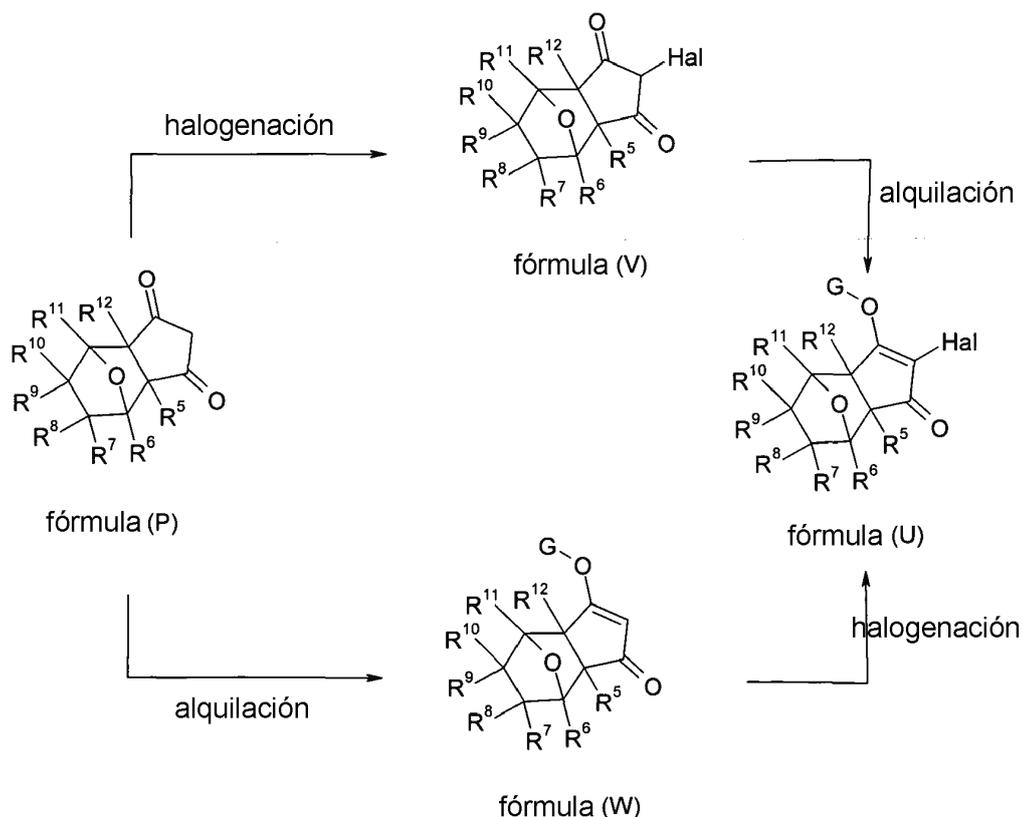
- 5 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula (A) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, en la que G es alquilo de C₁₋₄, mediante hidrólisis, preferiblemente en presencia de un catalizador ácido tal como ácido clorhídrico, y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, tal como tetrahidrofurano, acetona, o 4-metilpentan-2-ona.



- 10 Un compuesto de fórmula I, en la que G es alquilo de C₁₋₄, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (U), en la que G es alquilo de C₁₋₄, y Hal es halógeno (preferiblemente bromo o yodo), mediante acoplamiento con un ácido arilborónico de fórmula (O) en presencia de un catalizador de paladio adecuado y una base, y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado, y en un disolvente adecuado. Preferiblemente, el catalizador de paladio es acetato de paladio, la base es fosfato de potasio, y el ligando es 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo, y el disolvente es tolueno.

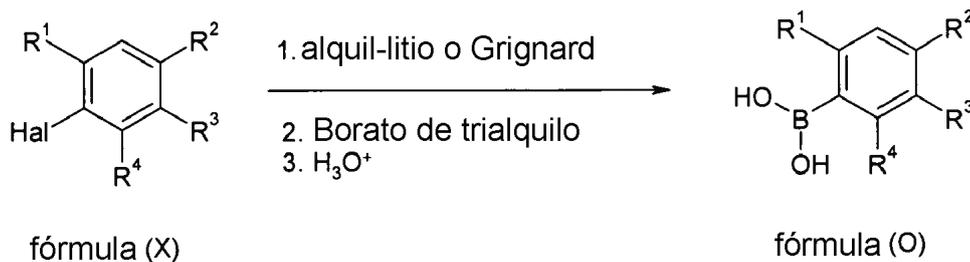


- 15 Un compuesto de fórmula (U) se puede preparar halogenando un compuesto de fórmula (P), seguido de la reacción del haluro resultante de fórmula (V) con un haluro de alquilo de C₁₋₄ u ortoformiato de trialquilo de C₁₋₄ en condiciones conocidas (por ejemplo mediante los procedimientos de R. Shepherd y A. White, J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 2153, e Y.-L. Lin et al. (Bioorg. Med. Chem. (2002), 10, 685). Como alternativa, un compuesto de fórmula (U) se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula (P) con un haluro de alquilo de C₁₋₄ o un ortoformiato de trialquilo de C₁₋₄, y halogenando la enona resultante de fórmula (W) en condiciones conocidas.
- 20



5

Un compuesto de fórmula (O) se puede preparar a partir de un haluro de arilo de Fórmula (X), en la que Hal es bromo o yodo, mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, W. Thompson y J. Gaudino, J. Org. Chem, 1984, 49, 5237, y R.T. Hawkins et al., J. Am. Chem. Soc., 1960, 82, 3053). Por ejemplo, un haluro de arilo de fórmula (X) se puede tratar con un alquil-litio o haluro de alquil-magnesio en un disolvente adecuado, preferiblemente éter dietílico o tetrahidrofurano, a una temperatura de entre -80°C y 30°C, y el reactivo de arilmagnesio o aril-litio obtenido se puede hacer reaccionar entonces con un borato de trialquilo (preferiblemente borato de trimetilo), para dar un dialquilboronato de arilo, que se puede hidrolizar para proporcionar un ácido borónico de fórmula (O) en condiciones ácidas.



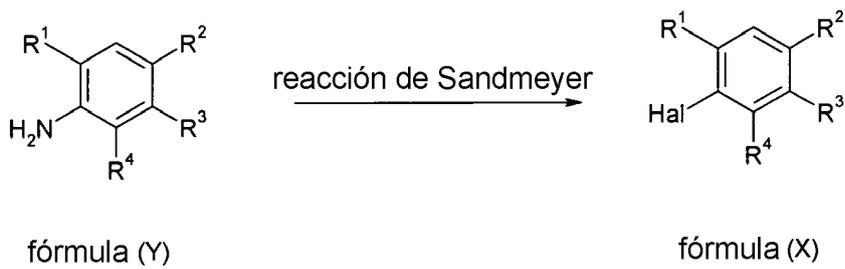
10

15

Como alternativa, un compuesto de fórmula (X) se puede hacer reaccionar con un éster de boronato cíclico derivado de un 1,2- o un 1,3-alcanodiol tal como pinacol, 2,2-dimetil-1,3-propanodiol y 2-metil-2,4-pentanodiol en condiciones conocidas (véanse, por ejemplo, N. Miyaura et al., J. Org. Chem., (1995), 60, 7508, y W. Zhu y D. Ma, Org. Lett., (2006), 8 (2), 261), y el éster de boronato resultante se puede hidrolizar en condiciones ácidas para dar un ácido borónico de fórmula (O).

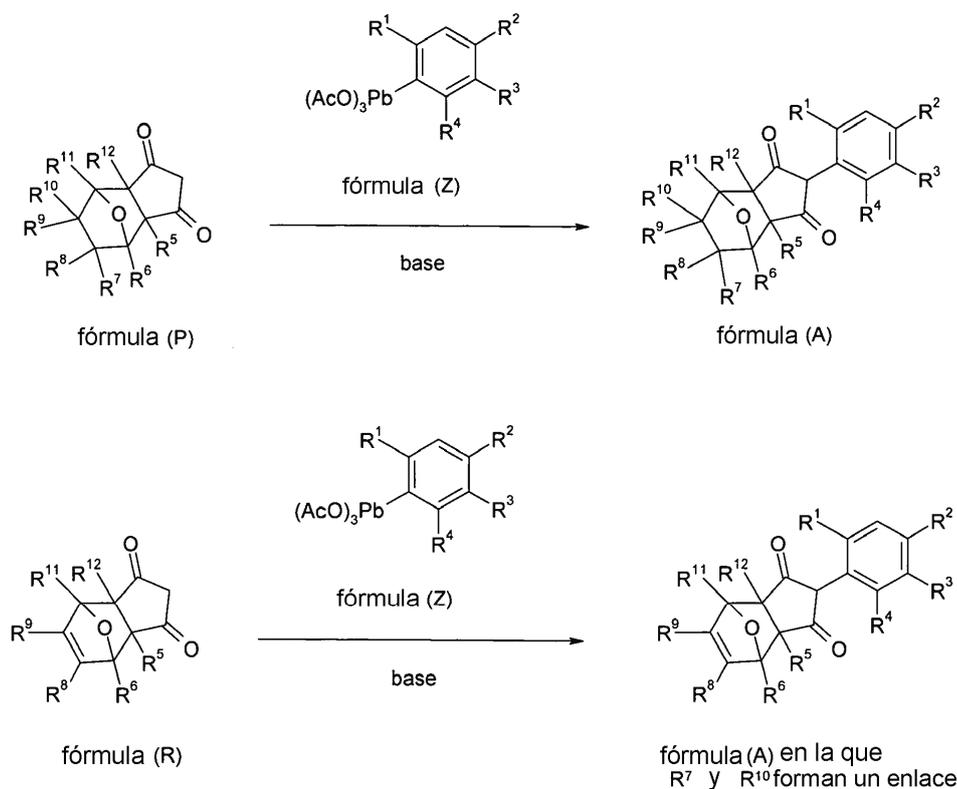
Un haluro de arilo de fórmula (X) se puede preparar a partir de una anilina de fórmula (Y) por métodos conocidos, por ejemplo la reacción de Sandmeyer, vía las sales de diazonio correspondientes.

Las anilinas de fórmula (Y) son compuestos conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos, mediante métodos conocidos.



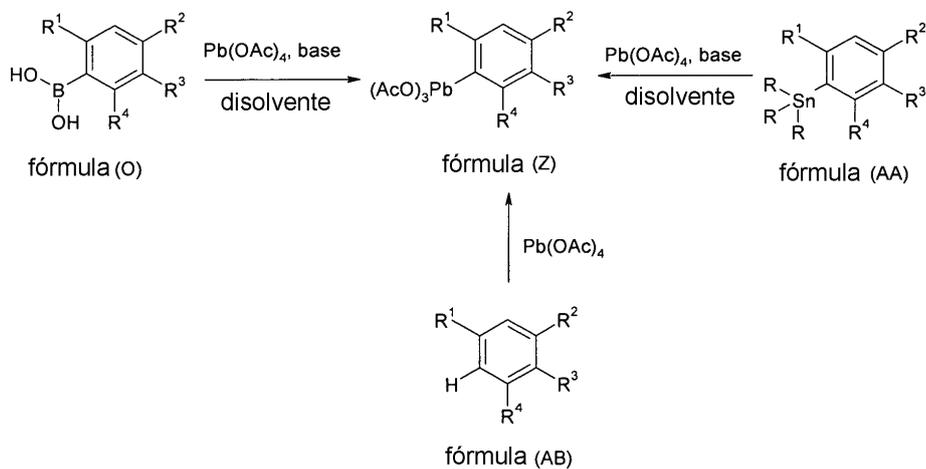
Compuestos adicionales de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (P), o un compuesto de fórmula (R), con un reactivo órgano-plumbífero de fórmula (Z) en las condiciones descritas, por ejemplo, por J. Pinhey, Pure and Appl. Chem., (1996), Vol. 68 (4), 819, y por M. Moloney et al., Tetrahedron Lett., (2002), 43, 3407.

5



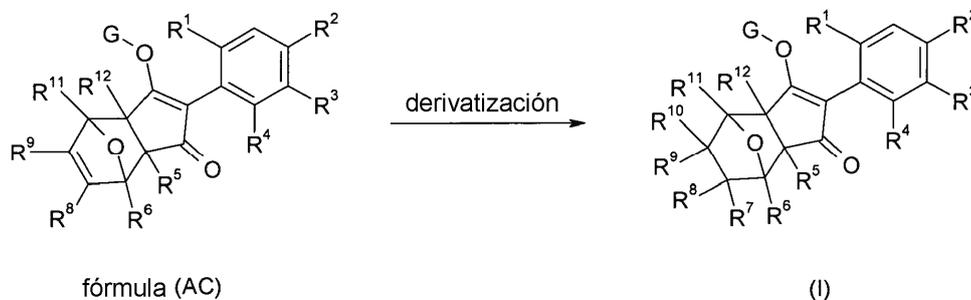
10

El reactivo órgano-plumbífero de fórmula (Z) se puede preparar a partir de un ácido borónico de fórmula (O), un estannano de fórmula (AA), en la que R es alquilo de C₁-C₄, o mediante plumbación directa de un compuesto de fórmula (AB) con tetraacetato de plomo según procedimientos conocidos.



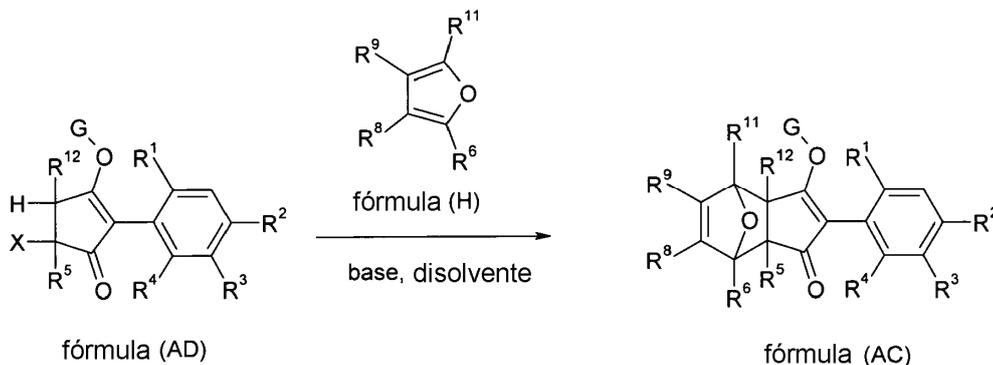
Otros compuestos de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (P) o un compuesto de fórmula (R) con un compuesto de triarilbismuto adecuado, en condiciones descritas, por ejemplo, por A. Yu. Fedorov et al., Russ. Chem. Bull. Int. Ed., (2005), 54 (11), 2602, y por P. Koech y M. Krische, J. Am. Chem. Soc., (2004), 126 (17), 5350 y las referencias allí.

5 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula I se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AC) mediante derivatización adecuada en condiciones estándar.



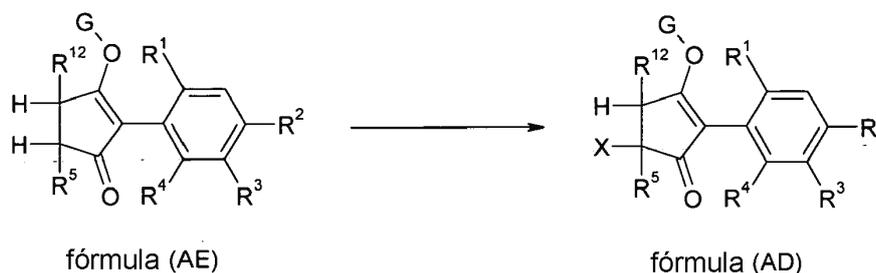
10 Por ejemplo, los compuestos de fórmula (AC) son alquenos, y como tales sufren reacciones adicionales típicas de alquenos para dar compuestos de fórmula I según procedimientos conocidos. Los ejemplos de tales reacciones incluyen, pero no se restringen a, reducción, halogenación, epoxidación, ciclopropanación, dihidroxilación, hidroarilación, hidroviniación e hidratación. Los compuestos de fórmula (AC) en la que R⁸ y R⁹ es bromo o yodo son haluros vinílicos, y sufren reacciones conocidas de haluros vinílicos, tales como las reacciones de Suzuki-Miyaura, Sonogashira, Stille, y reacciones relacionadas. Algunos otros compuestos de fórmula (AC), en la que R⁸ o R⁹ es alcoxi de C₁-C₆, son éteres enólicos, y éstos se pueden hidrolizar a la cetona correspondiente usando procedimientos estándar. A su vez, la cetona producida se puede transformar adicionalmente, por ejemplo mediante cetalización, oximación, reducción, y similar, en condiciones conocidas para dar compuestos adicionales de fórmula I. De forma similar, los compuestos de fórmula (AC) en la que R⁸ o R⁹ es amino de C₁-C₆ o diamino de C₁-C₆ son enaminas, y éstos también se pueden hidrolizar a la cetona correspondiente usando procedimientos estándar.

20 Un compuesto de fórmula (AC), en la que G es alquilo de C₁-C₄, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AD), en la que G es alquilo de C₁-C₄ y X es halógeno u otro grupo saliente adecuado (tal como un alquil o arilsulfonato, o un arilselenóxido), mediante reacción con un compuesto de fórmula (H), opcionalmente en un disolvente adecuado, y opcionalmente en presencia de una base adecuada.



25 Los disolventes adecuados incluyen tolueno, diclorometano y cloroformo, y las bases adecuadas incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, base de Hunig y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Preferiblemente, el disolvente es tolueno, y la base es 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno.

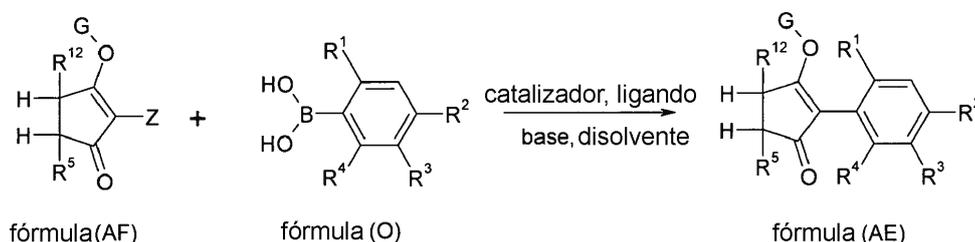
Un compuesto de fórmula (AD) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AE), en condiciones conocidas.



Por ejemplo, un compuesto de fórmula (AD) en la que X es cloro se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (AE) con cloruro de cobre (II) y cloruro de litio según el procedimiento de E. Kosower et al., J. Org. Chem., (1963), 28, 630.

5 Los compuestos de fórmula (AE) son compuestos conocidos o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos (véase, por ejemplo, Y. Song, B. Kim y J-N Heo, Tetrahedron Lett., (2005), 46, 5977). Como alternativa, un compuesto de fórmula (AE) en la que G es alquilo de C₁₋₄ se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AE), en la que G es hidrógeno, por ejemplo mediante reacción con un haluro de alquilo de C₁₋₄ o un ortoformiato de trialquilo de C₁₋₄. Los compuestos de fórmula (AE), en la que G es hidrógeno, son conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, T. Wheeler, documentos US4338122, US4283348, J. T. Kuethe et al., J. Org. Chem., (2002), 67, 5993, S. Buchwald et al., J. Am. Chem. Soc., (2003), 125, 11818).

15 Como alternativa, un compuesto de fórmula (AE), en la que G es alquilo de C₁₋₄, se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (AF), en la que G es alquilo de C₁₋₄ y Z es un halógeno, preferiblemente bromo o yodo, con un ácido borónico de fórmula (O) en presencia de un catalizador metálico adecuado, una base adecuada, y opcionalmente un ligando adecuado, en un disolvente adecuado.

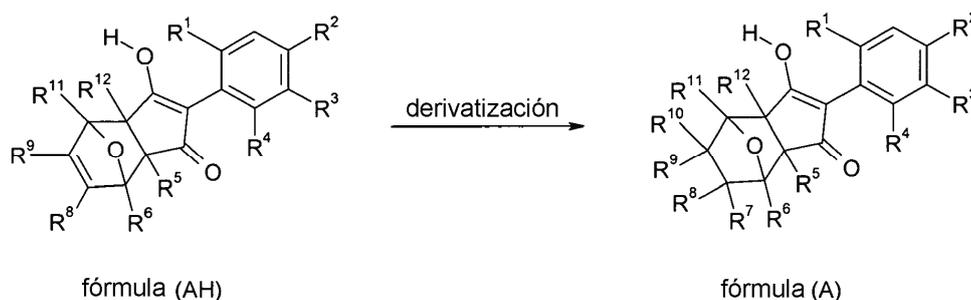


20 Los disolventes adecuados incluyen tolueno y *n*-butanol, las bases adecuadas incluyen bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, un catalizador metálico adecuado es un catalizador de paladio, por ejemplo en forma de acetato de paladio(II), y los ligandos adecuados incluyen fosfinas sustituidas, por ejemplo 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo.

25 Los compuestos de fórmula (AF) son compuestos conocidos, o se pueden preparar mediante métodos conocidos en la bibliografía. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (AF) en la que G es alquilo de C₁₋₄ y Z es un átomo de bromo se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (AG), en la que G es alquilo de C₁₋₄, con un agente bromante adecuado, tal como *N*-bromosuccinimida, en un disolvente adecuado, tal como 1,2-dicloroetano, como se describe por R. Shepherd y A. White, J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 10, 2153.



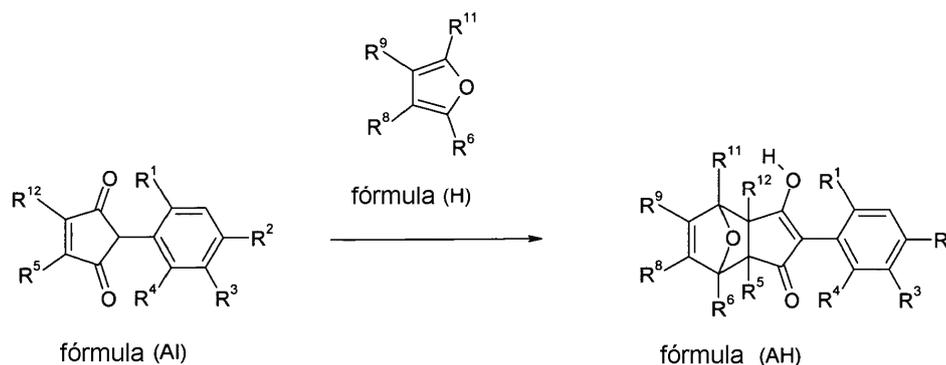
De manera similar, un compuesto de fórmula (A) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AH) mediante derivatización adecuada en condiciones estándar.



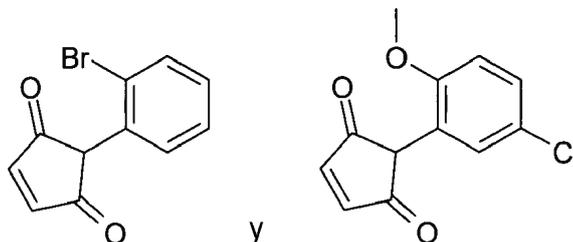
30 Por ejemplo, los compuestos de fórmula (AH) son alquenos, y como tales sufren reacciones adicionales típicas de alquenos para dar compuestos de fórmula (A) según procedimientos conocidos. Los ejemplos de tales reacciones incluyen, pero no se restringen a, reducción, halogenación, epoxidación, ciclopropanación, dihidroxilación,

hidroarilación, hidroviniación e hidratación. Los compuestos de fórmula (AH) en la que R^8 o R^9 es bromo o yodo son haluros vinílicos, y sufren reacciones conocidas de haluros vinílicos, tales como las reacciones de Suzuki-Miyaura, Sonogashira, Stille, y reacciones relacionadas. Algunos otros compuestos de fórmula (AH), en la que R^8 o R^9 es alcoxi de C_1-C_6 , son éteres enólicos, y éstos se pueden hidrolizar a la cetona correspondiente usando procedimientos estándar. A su vez, la cetona producida se puede transformar adicionalmente, por ejemplo mediante cetalización, oximación, reducción, y similar, en condiciones conocidas para dar compuestos adicionales de fórmula A. De forma similar, los compuestos de fórmula (AH) en la que R^8 o R^9 es amino de C_1-C_6 o diamino de C_1-C_6 son enaminas, y éstos también se pueden hidrolizar a la cetona correspondiente usando procedimientos estándar.

Un compuesto de fórmula (H) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AI) mediante reacción con un compuesto de fórmula (H), opcionalmente en un disolvente adecuado, y opcionalmente en presencia de un catalizador adecuado. Los compuestos de fórmula (AI) se han diseñado particularmente como intermedios en la síntesis de los compuestos de la fórmula I.



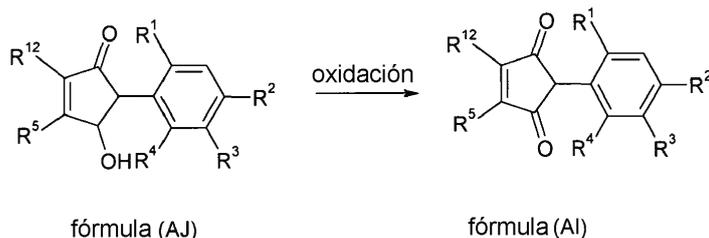
Los compuestos de la fórmula (AI) que tienen las fórmulas específicas



son conocidos con los números de Registro CAS 299968-82-4 y 528833-96-7, respectivamente.

Preferiblemente, el catalizador es un catalizador de ácido de Lewis tal como cloruro de aluminio, cloruro de bismuto (III), trifluorometanosulfonato de bismuto (III), trifluoruro de boro, cloruro de cesio (III), trifluorometanosulfonato de cobre (I), cloruro de dietilaluminio, cloruro de hafnio (IV), cloruro de hierro (III), perclorato de litio, trifluorometanosulfonato de litio, bromuro de magnesio, yoduro de magnesio, trifluorometanosulfonato de escandio (III), cloruro de estaño (IV), cloruro de titanio (IV), isopropóxido de titanio (IV), trimetilaluminio, bis(trifluorometanosulfonil)imiduro de N-trimetilsililo, trifluorometanosulfonato de trimetilsililo, trifluorometanosulfonato de iterbio (III), yoduro de cinc y cloruro de circonio (IV). Se prefiere particularmente yoduro de magnesio. Los disolventes adecuados incluyen aquellos que se sabe que son disolventes eficaces para llevar a cabo reacciones de Diels-Alder, entre ellos, por ejemplo, cloroformo, diclorometano, éter dietílico, etanol, metanol, alcanos perfluorados, tal como perfluorohexano, tolueno, agua, y líquidos iónicos tales como tetrafluoroborato de 1-butil-3-metilimidazolio y hexafluorofosfato de 1-butil-3-metilimidazolio. El diclorometano se prefiere particularmente como disolvente.

Un compuesto de fórmula (AI) se puede preparar oxidando un compuesto de fórmula (AJ) en un disolvente adecuado tal como tolueno, acetona, cloroformo, diclorometano o 1,4-dioxano. Un amplio intervalo de oxidantes son adecuados para efectuar esta transformación, incluyendo oxidantes inorgánicos tales como trióxido de cromo, dicromato de piridinio, dióxido de manganeso, y alcóxidos de aluminio tales como isopropóxido de aluminio, así como oxidantes orgánicos tales como 2,3-dicloro-5,6-diciano-*p*-benzoquinona, y oxidantes de yodo hipervalentes tales como 1,1,1-tris(acetiloxi)-1,1-dihidro-1,2-benzodioxol-3-(1H)-ona (peryodinano de Dess-Martin). Los procedimientos adecuados se describen, por ejemplo, por K. Saito y H. Yamachika, documento US4371711, y por G. Piancatelli et al., Tetrahedron (1978), 34, 2775. Se prefiere el uso de trióxido de cromo en una mezcla de ácido sulfúrico y acetona (reactivo de Jones).



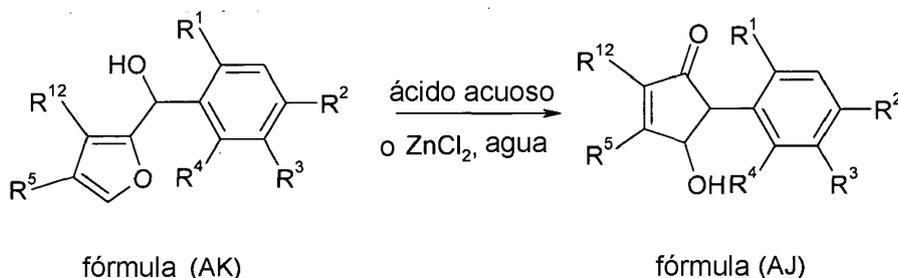
Los compuestos de la fórmula AI se han diseñado particularmente como intermedios para la síntesis de los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos particularmente útiles de la fórmula AI son aquellos en los que R^5 y R^{12} son hidrógeno.

5 En otro grupo de compuestos útiles de la fórmula I, R^1 , R^2 y R^4 son, independientemente entre sí, metilo o etilo.

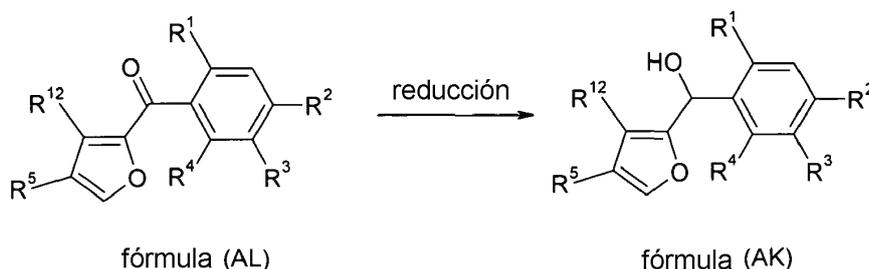
En otro grupo de compuestos útiles de la fórmula I, R^1 , R^2 y R^4 son, independientemente entre sí, metilo o etilo, y R^3 , R^5 y R^{12} son hidrógeno.

10 Un compuesto de fórmula (AJ) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AK) mediante tratamiento con un catalizador ácido adecuado en presencia de agua y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, según procedimientos conocidos.



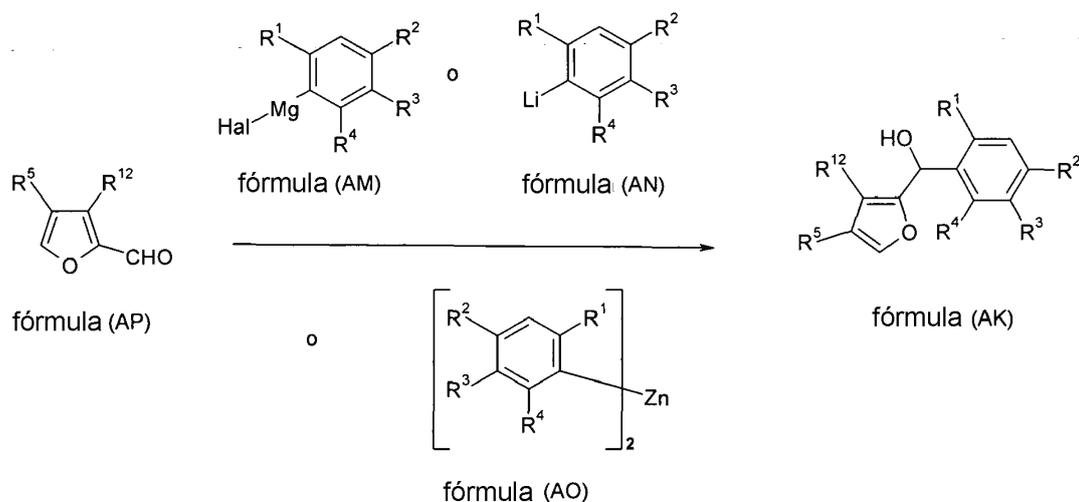
15 Por ejemplo, un compuesto de fórmula (AK) se puede convertir en un compuesto de fórmula (AJ) en presencia de una disolución acuosa de un ácido tal como ácido fosfórico o ácido polifosfórico como se describe, por ejemplo, por K. Saito y H. Yamachika, documento US4371711. Como alternativa, un compuesto de fórmula (AJ) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (AK) mediante transposición en presencia de un catalizador de ácido de Lewis tal como cloruro de cinc según el procedimiento de G. Piancatelli et al., *Tetrahedron*, (1978), 34, 2775.

Un compuesto de fórmula (AK) se puede preparar mediante la reducción de un compuesto de fórmula (AL) mediante condiciones conocidas (véase, por ejemplo, R Silvestri et al., *J. Med. Chem.*, 2005, 48, 4378-4388).

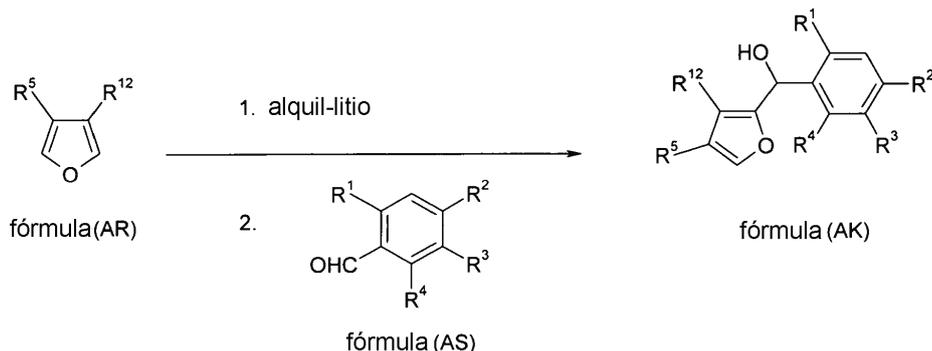


20 Los compuestos de fórmula (AL) son conocidos, o se pueden obtener mediante métodos conocidos a partir de compuestos conocidos (véanse, por ejemplo, L. Liebeskind et al., *Org. Lett.*, (2003), 5 (17), 3033-3035, H. Firouzabadi, N. Iranpoor y F. Nowrouzi, *Tetrahedron*, (2004), 60, 10843, R. Silvestri et al., *J. Med. Chem.*, (2005), 48, 4378 y referencias allí).

25 Como alternativa, un compuesto de fórmula (AK) se puede preparar mediante adición de un reactivo organometálico adecuado tal como un haluro de arilmagnesio de fórmula (AM), en la que Hal es un haluro tal como cloruro, bromuro o yoduro, o un reactivo de aril-litio de fórmula (AN), o un reactivo de diarilcinc de fórmula (AO), a un furan-2-carboxaldehído de fórmula (AP) según procedimientos conocidos (véase, por ejemplo, G. Panda et al., *Tetrahedron Lett.*, (2005), 46, 3097).



5 Compuestos adicionales de fórmula (AK) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (AR) mediante reacción con una base fuerte, por ejemplo un reactivo de alquil-litio tal como *n*-butil-litio, opcionalmente en presencia de un aditivo tal como tetrametilendiamina, y en un disolvente adecuado tal como éter dietílico o tetrahidrofurano, seguido de la reacción con un benzaldehído de fórmula (AS) como se describe, por ejemplo, por I. Gupta y M. Ravikanth, *J. Org. Chem.*, (2004), 69, 6796, A. M. Echavarren et al., *J. Am. Chem. Soc.*, (2003), 125 (19), 5757, y por T. K. Chandrashekar et al., *J. Org. Chem.*, (2002), 67, 6309-6319.



10 Los reactivos organometálicos de fórmula (AM), de fórmula (AN) y de fórmula (AO) son compuestos conocidos o se pueden obtener mediante métodos conocidos a partir de compuestos conocidos. Los compuestos de fórmula (AP), de fórmula (AR) y de fórmula (AS) son compuestos conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

15 Los compuestos de fórmula I según la invención se pueden usar como herbicidas en forma no modificada, como se obtienen en la síntesis, pero generalmente se formulan en composiciones herbicidas de diversas formas usando compuestos auxiliares de la formulación, tales como vehículos, disolventes y sustancias tensioactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, por ejemplo en forma de polvos finos, geles, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, comprimidos dispersables en agua, comprimidos prensados efervescentes, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua, sustancias oleosas capaces de fluir, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspensiones-emulsiones, suspensiones en cápsulas, gránulos emulsionables, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible con el agua como vehículo), películas de polímero impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo por *The Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products*, 5^a Edición, 1999. Dichas formulaciones se pueden usar tanto directamente como diluidas antes del uso. Las formulaciones diluidas se pueden preparar, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceites o disolventes.

25 Las formulaciones se pueden preparar, por ejemplo, mezclando el ingrediente activo con los compuestos auxiliares de la formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, disoluciones, dispersiones o emulsiones. Los ingredientes activos también se pueden formular con otros compuestos auxiliares, por ejemplo sólidos finalmente divididos, aceites minerales, aceites vegetales, aceites vegetales modificados, disolventes orgánicos, agua, sustancias tensioactivas, o combinaciones de los mismos. Los ingredientes activos pueden también estar contenidos en microcápsulas muy finas que consisten en un polímero. La microcápsulas contienen los ingredientes activos en un soporte poroso. Esto permite que los ingredientes activos se liberen al entorno en cantidades controladas (por ejemplo, liberación lenta). Las microcápsulas tienen habitualmente un

diámetro de 0,1 a 500 micrómetros. Contienen ingredientes activos en una cantidad de alrededor de 25 a 95% en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar presentes en forma de un sólido monolítico, en forma de partículas finas en una dispersión sólida o líquida, o en forma de una disolución adecuada. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, gomas naturales y sintéticas, celulosa, copolímeros de estireno-butadieno, poliacrilonitrilo, poliácido, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretano o polímeros modificados químicamente y xantatos de almidón u otros polímeros que son conocidos por la persona experta en la técnica a este respecto. Alternativamente, se pueden formar microcápsulas muy finas en las que el ingrediente activo está presente en forma de partículas muy finas en una matriz sólida de sustancia base, pero en ese caso la microcápsula no está encapsulada.

Los compuestos auxiliares de la formulación adecuados para la preparación de las composiciones según la invención son conocidos *per se*. Como vehículos líquidos, se pueden usar: agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceites vegetales, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, anhídridos de ácidos, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butilenos, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, ésteres alquílicos de ácido acético, diacetona alcohol, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, éter butílico de dietilenglicol, éter etílico de dietilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, éter metílico de dipropilenglicol, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, éter butílico de etilenglicol, éter metílico de etilenglicol, gamma-butirolactona, glicerol, acetato de glicerilo, diacetato de glicerilo, triacetato de glicerilo, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, metil isoamil cetona, metil isobutil cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, n-hexano, n-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG 400), ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, éter metílico de propilenglicol, p-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, éter metílico de propilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, metanol, etanol, isopropanol, y alcoholes de peso molecular más alto, tales como alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, N-metil-2-pirrolidona, y similares. El agua es generalmente el vehículo de elección para diluir los concentrados. Vehículos sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla de pirofilita, sílice, arcilla de atapulgita, kieselguhr, piedra caliza, carbonato cálcico, bentonita, montmorillonita cálcica, vainas de las semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, cáscaras molidas de nueces, lignina y sustancias parecidas, como se describe, por ejemplo, en el documento CFR 180.1001. (c) y (d).

Se puede usar ventajosamente un gran número de sustancias tensioactivas, tanto en formulaciones sólidas como líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que pueden diluirse con un vehículo antes del uso. Las sustancias tensioactivas pueden ser aniónicas, catiónicas, no iónicas o poliméricas, y se pueden usar como agentes emulsionantes, humectantes o agentes de suspensión, o para otros fines. Sustancias tensioactivas típicas incluyen, por ejemplo, las sales de alquilsulfatos, tales como laurilsulfato de dietilamonio; sales de alquilarilsulfonatos, tales como dodecibencenosulfonato cálcico; productos de adición de alquilfenol-óxido de alquileo, tales como etoxilato de nonilfenol; productos de adición de alcohol-óxido de alquileo, tales como etoxilato del alcohol tridecílico; jabones, tales como estearato sódico; sales de alquilnaftalenosulfonatos, tales como dibutilnaftalenosulfonato sódico; ésteres de dialquilo de sales de sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato sódico; ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio, ésteres de polietilenglicol con ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloques de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de mono- y di-alquilsulfato; y también sustancias adicionales descritas por ejemplo en "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood Nueva Jersey, 1981.

Compuestos auxiliares adicionales que se pueden usar usualmente en formulaciones de plaguicidas incluyen los inhibidores de la cristalización, sustancias modificadoras de la viscosidad, agentes de suspensión, tintes, antioxidantes, agentes espumantes, agentes que absorben la luz, compuestos auxiliares de mezclamiento, antiespumantes, agentes formadores de complejos, sustancias neutralizantes o modificadoras del pH y tampones, inhibidores de la corrosión, fragancias, agentes humectantes, potenciadores de la absorción, micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas, y también fertilizantes líquidos y sólidos.

Las formulaciones también pueden comprender sustancias activas adicionales, por ejemplo otros herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas.

Las composiciones según la invención pueden incluir adicionalmente un aditivo que comprende un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres alquílicos de dichos aceites, o mezclas de dichos aceites y derivados de aceites. La cantidad de aditivo oleoso en la composición según la invención es generalmente de 0,01 a 10%, basada en la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso se puede añadir al tanque de pulverización en la concentración deseada después de que se haya preparado la mezcla de pulverización. Aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de semilla de colza, aceite de oliva

o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado, tal como AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.), ésteres de alquilo de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados metílicos, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de buey. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos, esencialmente 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de colza metilado, y también 5% en peso de emulsionantes y agentes modificadores de pH usuales. Aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden los ésteres alquílicos de los ácidos grasos de C₈-C₂₂, especialmente los derivados metílicos de ácidos grasos de C₁₂-C₁₈, siendo importantes por ejemplo los ésteres metílicos del ácido láurico, palmítico y oleico. Esos ésteres son conocidos como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de éster metílico de ácido graso preferido es Emery® 2230 y 2231 (Cognis GmbH). Estos y otros derivados oleosos son también conocidos del Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ª edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y acción de los aditivos oleosos se puede mejorar adicionalmente combinándolos con sustancias tensioactivas, tales como tensioactivos no iónicos, aniónicos o catiónicos. En el documento WO 97/34485, páginas 7 y 8, se dan ejemplos de tensioactivos aniónicos, no iónicos y catiónicos adecuados. Las sustancias tensioactivas preferidas son los tensioactivos aniónicos del tipo dodecylbencenosulfonato, especialmente las sales de calcio de los mismos, y también los tensioactivos no iónicos del tipo etoxilato de alcohol graso. Se da preferencia especial a los alcoholes grasos de C₁₂-C₂₂ etoxilados que tienen un grado de etoxilación de 5 a 40. Ejemplos de tensioactivos comercialmente disponibles son los tipos Genapol (Clariant AG). También se prefieren los tensioactivos de silicona, especialmente heptametiltriloxanos modificados con poli(óxidos de alquilo), que están comercialmente disponibles como, por ejemplo, Silwet L-77®, y también tensioactivos perfluorados. La concentración de las sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total es en general de 1 a 30% en peso. Ejemplos de aditivos oleosos que consisten en mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de los mismos con tensioactivos son Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) o Actipron® (BP Oil UK Limited, GB).

También es posible usar por sí mismas en las formulaciones las sustancias tensioactivas mencionadas, es decir, sin aditivos oleosos.

Además, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/tensioactivo puede contribuir a una mejora adicional de la acción. Disolventes adecuados son, por ejemplo, Solvesso® (ESSO) y Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). La concentración de dichos disolventes puede ser de 10 a 80% en peso del peso total. Por ejemplo, en el documento US-A-4.834.908 se describen tales aditivos oleosos que pueden estar presentes mezclados con disolventes. Un aditivo oleoso comercialmente disponible descrito en este documento se conoce con el nombre MERGE® (BASF Corporation). Aditivos oleosos adicionales que se prefieren según la invención son SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada) y Adigor® (Syngenta Crop Protection Canada).

Además de los aditivos oleosos listados anteriormente, con el fin de potenciar la actividad de las composiciones según la invención, también es posible añadir formulaciones de alquilpirrolidonas (por ejemplo Agrimax®) a la mezcla de pulverización. También se pueden usar formulaciones de látex sintéticos, por ejemplo compuestos de poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-p-menteno (por ejemplo Bond®, Courier® o Emerald®). También es posible añadir a la mezcla de pulverización, como agente potenciador de la actividad, disoluciones que contengan ácido propiónico, por ejemplo Eurokem Pen-e-trate®.

Las formulaciones herbicidas generalmente contienen de 0,1 a 99% en peso, especialmente de 0,1 a 95% en peso, de compuestos de fórmula I, y de 1 a 99,99% en peso de un compuesto auxiliar de la formulación, que incluye preferiblemente de 0 a 25% en peso de una sustancia tensioactiva. Mientras que los productos comerciales se formularán preferiblemente como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas.

La tasa de aplicación de los compuestos de fórmula I puede variar dentro de límites amplios, y depende de la naturaleza del suelo, del método de aplicación (pre- o post-emergencia; tratamiento de semillas; aplicación en el surco de siembra; no aplicación de cultivo, etc.), de la planta de cosecha, de la hierba o malas hierbas a controlar, de las condiciones climáticas prevalentes, y de otros factores gobernados por el método de aplicación, el tiempo de aplicación y la cosecha diana. Los compuestos de fórmula I según la invención se aplican generalmente a una tasa de 1 a 2000 g/ha, preferiblemente 1-1000 g/ha, y muy preferiblemente a 1-500 g/ha.

Las formulaciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones (% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

Ingrediente activo: 1 a 95%, preferiblemente 60 a 90%

Agente tensioactivo: 1 a 30%, preferiblemente 5 a 20%

Vehículo líquido: 1 a 80%, preferiblemente 1 a 35%

Polvos:

ES 2 497 501 T3

Ingrediente activo:	0,1 a 10%, preferiblemente 0,1 a 5%
Vehículo sólido:	99,9 a 90%, preferiblemente 99,9 a 99%
Concentrados en suspensión:	

Ingrediente activo:	5 a 75%, preferiblemente 10 a 50%
Agua:	94 a 24%, preferiblemente 88 a 30%
Agente tensioactivo:	1 a 40%, preferiblemente 2 a 30%

Polvos humectables:

Ingrediente activo:	0,5 a 90%, preferiblemente 1 a 80%
Agente tensioactivo:	0,5 a 20%, preferiblemente 1 a 15%
Vehículo sólido:	5 a 95 %, preferiblemente 15 a 90%

Gránulos:

Ingrediente activo:	0,1 a 30%, preferiblemente 0,1 a 15%
Vehículo sólido:	99,5 a 70%, preferiblemente 97 a 85%

Los Ejemplos siguientes ilustran más ampliamente, pero no limitan, la invención.

<u>F1. Concentrados emulsionables</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5%	10%	25%	50%
Dodecibencenosulfonato de calcio	6%	8%	6%	8%
éter poliglicólico de aceite de ricino (36 moles de óxido de etileno)	4%	-	4%	4%
éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	-	4%	-	2%
NMP	-	-	10%	20%
Mezcla de hidrocarburos aromáticos de C ₉ -C ₁₂	85%	78%	55%	16%

Pueden prepararse emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de tales concentrados por dilución con agua.

<u>F2. Disoluciones</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5%	10%	50%	90%
1-metoxi-3-(3-metoxi-propoxi)-propano	-	20%	20%	-
Polietilenglicol MW 400	20%	10%	-	-
NMP	-	-	30%	10%
Mezcla de hidrocarburos aromáticos de C ₉ -C ₁₂	75%	60%	-	-

Las disoluciones son adecuadas para uso en forma de microgotas.

<u>F3. Polvos humectables</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5%	25%	50%	80%
Lignosulfonato de sodio	4%	-	3%	-
Laurilsulfato sódico	2%	3%	-	4%

ES 2 497 501 T3

Diisobutilnaftalensulfonato sódico	-	6%	5%	6%
Éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
Ácido silícico muy dispersado	1%	3%	5%	10%
Caolín	88%	62%	35%	-

El ingrediente activo se mezcla a conciencia con los compuestos auxiliares, y la mezcla se tritura a conciencia en un molino adecuado, dando lugar a polvos humectables que pueden diluirse con agua para dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

F4. Gránulos revestidos

	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1%	5%	15%
Ácido silícico muy dispersado	0,9%	2%	2%
Vehículo inorgánico (diámetro 0,1-1 mm) por ejemplo CaCO ₃ o SiO ₂	99,0%	93%	83%

5 El ingrediente activo se disuelve en cloruro de metileno, la disolución se pulveriza sobre el vehículo, y entonces el disolvente se separa por evaporación a vacío.

F5. Gránulos revestidos

	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1%	5%	15%
Polietilenglicol PM 200	1,0%	2%	3%
Ácido silícico muy dispersado	0,9%	1%	2%
Vehículo inorgánico (diámetro 0,1-1 mm) p. ej. CaCO ₃ o SiO ₂	98,0%	92%	80%

El ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente, en una mezcladora, al vehículo humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen gránulos revestidos no pulverulentos.

F6. Gránulos extruidos

	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	0,1%	3%	5%	15%
Lignosulfonato de sodio	1,5%	2%	3%	4%
Carboximetilcelulosa	1,4%	2%	2%	2%
Caolín	97,0%	93%	90%	79%

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los compuestos auxiliares, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extruye y luego se seca en una corriente de aire.

F7. Polvos:

	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1%	1%	5%
Talco	39,9%	49%	35%
Caolín	60,0%	50%	60%

10 Se obtienen polvos listos para usar mezclando el ingrediente activo con los vehículos y triturando la mezcla en un molino adecuado.

F8. Concentrados en suspensión:

	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	3%	10%	25%	50%
etilenglicol	5%	5%	5%	5%

nonilfenol poliglicol éter (15 moles de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
lignosulfonato de sodio	3%	3%	4%	5%
carboximetilcelulosa	1%	1%	1%	1%
disolución acuosa al 37% de formaldehído	0,2%	0,2%	0,2%	0,2%
emulsión de aceite de silicona	0,8%	0,8%	0,8%	0,8%
agua	87%	79%	62%	38%

El ingrediente activo finamente triturado se mezcla íntimamente con los compuestos auxiliares, dando un concentrado en suspensión del que se puede preparar cualquier concentración deseada por dilución con agua.

5 La invención también se refiere a un método para controlar selectivamente hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, y para el control no selectivo de malas hierbas, el cual comprende aplicar a las plantas útiles o al área de cultivo, o a su locus, con un compuesto de fórmula I.

Los cultivos de plantas útiles en los que se puede usar las composiciones según la invención incluyen especialmente cereales, en particular trigo y cebada, arroz, maíz, colza, remolacha, caña de azúcar, haba de soja, algodón, girasol, cacahuete y cultivos de plantación.

10 El término "cultivos" debe entenderse que incluye también cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO, y HPPD) como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha hecho tolerante, por ejemplo a imidazolinonas, tales como imazamox, por métodos convencionales de reproducción es colza de verano (cánola) Clearfield®. Ejemplos de cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas por métodos de ingeniería genética incluyen, por ejemplo, variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®. Las malas hierbas a controlar pueden ser tanto malas hierbas monocotiledóneas como dicotiledóneas, tales como, por ejemplo, Stellaria, Nasturtium, Agrostis, Digitaria, Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola y Veronica. El control de malas hierbas monocotiledóneas, en particular Agrostis, Avena, Setaria, Lolium, Echinochloa, Bromus, Alopecurus y Sorghum, es muy amplio.

20 También se entiende que los cultivos son aquellos que se han hecho resistentes a insectos dañinos por métodos de ingeniería genética, por ejemplo maíz Bt (resistente al taladrador del maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo del algodón) y también patatas Bt (resistentes al escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína que se forma de manera natural por las bacterias del suelo *Bacillus thuringiensis*. Ejemplos de toxinas y plantas transgénicas que pueden sintetizar tales toxinas se describen en los documentos EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427529. Ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y su material de semilla pueden ser resistentes a herbicidas y, al mismo tiempo, también resistentes a la alimentación de los insectos (acontecimientos transgénicos "apilados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de expresar una proteína insecticidamente activa Cry3 mientras que al mismo tiempo son tolerantes al glifosato. Se entiende que el término "cultivos" incluye también cultivos que se obtienen por métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética y que contienen los así llamados rasgos de producción total (por ejemplo, mejor sabor, estabilidad durante el almacenamiento, contenido nutricional).

Se entiende que las áreas en cultivo incluyen tierra sobre la que las plantas de cultivo están ya creciendo, así como la tierra destinada al cultivo de esas plantas de cultivo.

40 Los compuestos de fórmula I según la invención también se pueden usar en combinación con otros herbicidas. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de fórmula I es uno de los compuestos enumerados en las Tablas 1 a 146 más abajo. Son especialmente importantes las siguientes mezclas del compuesto de fórmula I:

45 compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfen-sodio, compuesto de fórmula I + aclonifen, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopiralida, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de fórmula I + anilofós, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benazolina, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo,

compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzfendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafós, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + bórax, compuesto de fórmula I + bromacilo, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + butamifós, compuesto de fórmula I + butralina, compuesto de fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cifenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + clorfloreol, compuesto de fórmula I + clorfloreol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + clorimurón, compuesto de fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorpropham, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + clortal, compuesto de fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I + desmedipham, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + orto-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + para-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclorprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenican, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrin, compuesto de fórmula I + dimetenamid, compuesto de fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de fórmula I + dimetipin, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarsínico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamid, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diurón, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfluralin, compuesto de fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifeno, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula I + etobenzanida, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop-P, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloralin, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpiretilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofeno, compuesto de fórmula I + fluoroglycofenethyl, compuesto de fórmula I + flupropanate, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metilo-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula I + fomesafeno, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amónico, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula I + HC-252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapyr, compuesto de fórmula I + imazaquin, compuesto de fórmula I + imazethapyr, compuesto de fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofan, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + yoxinilo, compuesto de fórmula I + isoprotritol, compuesto de fórmula I + isouril, compuesto de fórmula I + isoxaben, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofeno, compuesto de fórmula I + lenacilo, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I +

MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mafenacet, compuesto de fórmula I + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metabenziazurón, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S-metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalina, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazona, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfenol, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamida, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + piperofós, compuesto de fórmula I + arsenito potásico, compuesto de fórmula I + azida potásica, compuesto de fórmula I + pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluzol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraclonilo, compuesto de fórmula I + piraflufeno, compuesto de fórmula I + piraflufeno-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifeno, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piriftalida, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfan, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quinclorac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quinoclamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito de sodio, compuesto de fórmula I + azida sódica, compuesto de fórmula I + clorato de sodio, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio, compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacilo, compuesto de fórmula I + terbumetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + tri-alato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopyir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridilo]acético (CAS RN 353292-31-6), compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiliofen-3-carboxílico (BAY636), compuesto de fórmula I + BAY747 (CAS RN 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topramezona (CAS RN 210631-68-8), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (CAS RN 352010-68-5), y compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

Las parejas de mezclamiento para el compuesto de fórmula I también pueden estar en forma de ésteres o sales, como se menciona por ejemplo en The Pesticide Manual, 12ª edición (BCPC), 2000.

Los compuestos de fórmula I según la invención también se pueden usar en combinación con protectores de herbicidas. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I es uno de esos compuestos listados en las Tablas 1 a 146 más abajo. Especialmente se toman en consideración las siguientes mezclas con protectores de herbicidas:

- 5 compuesto de fórmula I + cloquintocet-mexilo, compuesto de fórmula I + cloquintocet ácido y sus sales, compuesto de fórmula I + fenclorazol-etilo, compuesto de fórmula I + fenclorazol ácido y sus sales, compuesto de fórmula I + mefenpir-dietilo, compuesto de fórmula I + mefenpir diácido, compuesto de fórmula I + isoxadifen-etilo, compuesto de fórmula I + isoxadifen ácido, compuesto de fórmula I + furilazol, compuesto de fórmula I + isómero R de furilazol, compuesto de fórmula I + N-(2-metoxibenzoil)-4-
 10 [(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, compuesto de fórmula I + benoxacor, compuesto de fórmula I + diclormida, compuesto de fórmula I + AD-67, compuesto de fórmula I + oxabetrinilo, compuesto de fórmula I + cimetrinilo, compuesto de fórmula I + isómero Z de cimetrinilo, compuesto de fórmula I + fenclorim, compuesto de fórmula I + ciprosulfamida, compuesto de fórmula I + anhídrido naftálico, compuesto de fórmula I + flurazol, compuesto de fórmula I + CL 304,415, compuesto de fórmula I + diciclonón, compuesto de fórmula I + fluxofenim,
 15 compuesto de fórmula I + DKA-24, compuesto de fórmula I + R-29148 y compuesto de fórmula I + PPG-1292. También se puede observar un efecto de protección para las mezclas compuesto de la fórmula I + dimron, compuesto de la fórmula I + MCPA, compuesto de la fórmula I + mecoprop y compuesto de la fórmula I + mecoprop-P.

20 Los protectores y herbicidas mencionados anteriormente se describen, por ejemplo, en el Pesticide Manual, Twelfth Edition, British Crop Protection Council, 2000. R-29148 se describe, por ejemplo, por P. B. Goldsbrough et al., Plant Physiology, (2002), Vol. 130 p. 1497-1505 y referencias allí; PPG-1292 es conocido a partir del documento WO09211761, y la N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida es conocida desde el documento EP365484.

25 Se prefieren especialmente benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciprosulfamida, mefenpir-dietilo, y N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, en el que cloquintocet-mexilo es particularmente valioso.

Se prefiere aplicar el otro herbicida junto con uno de los protectores mencionados anteriormente.

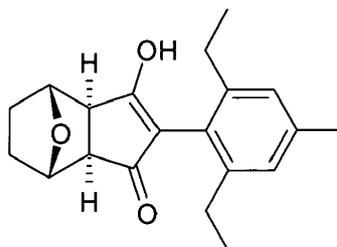
Los siguientes Ejemplos ilustran la invención adicionalmente, pero no limitan la invención.

Ejemplos de preparación:

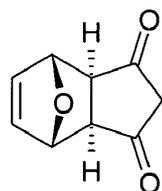
30 Los expertos en la técnica apreciarán que ciertos compuestos descritos más abajo son β -cetoenoles, y, como tales, pueden existir como un tautómero individual o como una mezcla de tautómeros ceto-enólicos y dicetónicos, como se describe, por ejemplo, por J. March, Advanced Organic Chemistry, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos mostrados más abajo, y en la Tabla T1, se dibujan como un tautómero enólico individual arbitrario, pero se debería inferir que esta descripción cubre tanto la forma dicetónica como cualesquiera posibles enoles que
 35 pudiesen surgir por tautomería. Cuando se observa más de un tautómero en RMN protónica, los datos mostrados son para la mezcla de tautómeros. Además, algunos de los compuestos mostrados más abajo se dibujan como enantiómeros individuales con fines de simplicidad, pero excepto que se especifiquen como enantiómeros individuales, estas estructuras se deberían interpretar como una mezcla de enantiómeros. Adicionalmente, algunos de los compuestos pueden existir como diastereoisómeros, y se debería inferir que estos pueden estar presentes como una mezcla de diastereoisómeros o como cualquier diastereómero individual posible. Dentro de la sección
 40 experimental detallada, el tautómero dicetónico se escoge con fines de nomenclatura, incluso si el tautómero predominante es la forma enólica.

Ejemplo 1

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

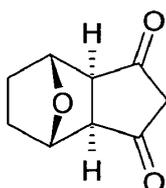


45 Etapa 1: Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.



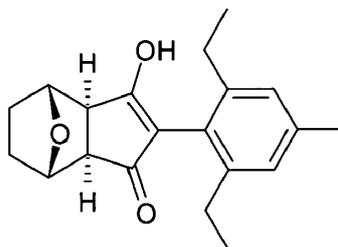
Se añade furano (13,9 ml, 0,19 moles) a ciclopenten-1,4-diona (18,4 g, 0,19 moles), y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 5 días. La mezcla se diluye con metanol, y se recoge (1RS,2SR,6RS,7SR)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona mediante filtración, y se usa sin purificación adicional en la etapa siguiente.

5 Etapa 2: Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



10 La (1RS,2SR,6RS,7SR)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (2,1 g, 12,8 mmoles), preparada en la Etapa 1, se disuelve en metanol caliente (180 ml), y la mezcla se deja enfriar hasta la temperatura ambiente. La mezcla se hidrogena entonces en presencia de paladio al 5% sobre carbono (aprox. 50 mg) a 3,5 bares durante 4 horas. El catalizador se elimina mediante filtración a través de tierra de diatomeas, y el filtrado se concentra a presión reducida para producir (1RS,2SR,6RS,7SR)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

Etapa 3: Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



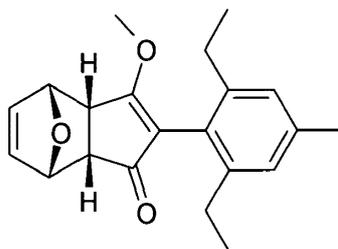
15 Se suspenden diacetato de yodobenceno (10,3 g, 32,0 moles) y carbonato de sodio (3,38 g, 32,0 mmoles) en agua (100 ml), y la suspensión amarilla resultante se agita a temperatura ambiente durante 30 minutos. Mientras tanto, se añade (1RS,2SR,6RS,7SR)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (5,3 g, 32,0 moles) a una disolución de carbonato de sodio (3,38 g, 32,0 moles) en agua (50 ml) y etanol (50 ml), y la mezcla se agita a temperatura ambiente para producir una disolución naranja. Las dos mezclas se combinan y se agitan durante 3 horas a temperatura ambiente, después la mezcla se vierte en agua y se extrae con diclorometano. Los extractos orgánicos se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar un iluro de yodonio, que se usa sin purificación adicional en la etapa siguiente.

20 El iluro de yodonio (3 g, 8,15 mmoles), preparado anteriormente, se añade a una disolución de ácido 2,6-dietil-4-metilfenilborónico (1,57 g, 8,15 mmoles), bromuro de tetrabutilamonio (2,63 g, 8,15 mmoles), hidróxido de litio monohidratado (1,03 g, 24,5 mmoles) y acetato de paladio (II) (92 mg, 0,41 mmoles) en 1,2-dimetoxietano (80 ml) y agua (20 ml), y la mezcla de reacción se calienta a 50°C durante 5 horas en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se enfría hasta la temperatura ambiente y se reparte entre ácido clorhídrico acuoso diluido y acetato de etilo. La fase orgánica se extrae entonces en disolución acuosa 0,5 M de carbonato de potasio, y la fase orgánica se desecha. La fase acuosa se acidifica con ácido clorhídrico concentrado y se extrae con acetato de etilo. El extracto orgánico se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para producir (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

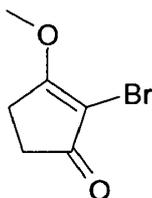
30 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,88 - 6,87 (2H, m), 4,55 - 4,54 (2H, m), 2,62 (2H, s), 2,36 - 2,27 (7H, m), 1,69 - 1,67 (2H, m), 1,40 - 1,39 (2H, m), 1,03 (6H, q).

Ejemplo 2

35 Preparación de (1RS,2RS,6SR,7SR)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona.

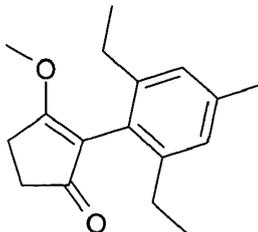


Etapa 1: Preparación de 2-bromo-3-metoxiciclopent-2-enona.



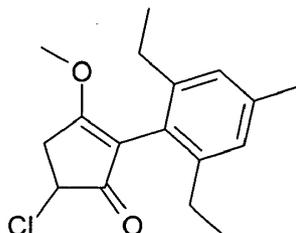
5 Se añade *N*-bromosuccinimida (24,92 g, 0,140 moles) en porciones, durante 1 hora, a una disolución agitada de 3-metoxiciclopent-2-enona (14,95 g, 0,133 moles) en 1,2-dicloroetano (300 ml) a 0°C en un matraz ámbar. La mezcla de reacción se agita a 0°C durante otros 90 minutos, y después cualquier sólido restante se elimina mediante filtración. El filtrado se evapora hasta sequedad a presión reducida, el sólido resultante se disuelve en tolueno caliente (600 ml) y se lava rápidamente con agua enfriada con hielo (2 x 100 ml). La fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida hasta que quedan aproximadamente 150 ml. El residuo se enfría con un baño de hielo y se deja durante 30 minutos. El sólido resultante se elimina mediante filtración, se lava con hexano (50 ml) y se seca al aire para dar 2-bromo-3-metoxiciclopent-2-enona.

Etapa 2: Preparación de 2-(2,6-dietil-4-metilfenil)-3-metoxiciclopent-2-enona.



15 A una suspensión agitada de 2-bromo-3-metoxiciclopent-2-enona (17,5 g, 91,6 mmoles), ácido 2,6-dietil-4-metilfenilborónico (26,4 g, 137 mmoles) y fosfato de potasio en polvo recién preparado (38,9 g, 183 mmoles) en tolueno desgasificado anhidro, (450 ml) en una atmósfera de nitrógeno, se añaden acetato de paladio (II) (0,411 g, 1,83 mmoles) y 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo (1,51 g, 3,67 mmoles). La mezcla de reacción se calienta a 90°C durante 6,5 horas y después se deja enfriar hasta la temperatura ambiente toda la noche. La reacción se diluye con agua (400 ml) y se extrae con acetato de etilo (3 x 150 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavan con salmuera (50 ml), se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora hasta sequedad a presión reducida para dar un aceite marrón. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(2,6-dietil-4-metilfenil)-3-metoxiciclopent-2-enona.

Etapa 3: Preparación de 5-cloro-2-(2,6-dietil-4-metilfenil)-3-metoxiciclopent-2-enona.

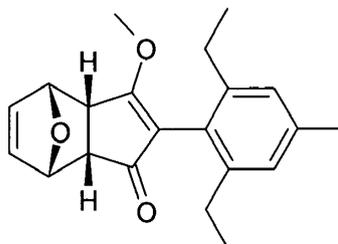


25 A una disolución agitada de 2-(2,6-dietil-4-metilfenil)-3-metoxiciclopent-2-enona (0,715 g, 2,77 mmoles) en 1,4-dioxano (45 ml), y en una atmósfera de nitrógeno, se añaden cloruro de cobre (II) (0,743 g, 5,53 mmoles) y cloruro de litio (0,176 g, 4,15 mmoles). La reacción se calienta a reflujo durante 7 horas y se deja enfriar hasta la temperatura ambiente toda la noche. El sólido que queda se elimina mediante filtración y se lava con acetato de etilo

(50 ml). El filtrado se lava con agua (2 x 25 ml), y los lavados acuosos se vuelven a extraer con acetato de etilo (15 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavan con salmuera (15 ml), se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar un aceite marrón. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5-cloro-2-(2,6-dietil-4-metilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona.

5

Etapa 4: Preparación de (1*RS*,2*RS*,6*SR*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona.



A una disolución agitada de 5-cloro-2-(2,6-dietil-4-metilfenil)-3-metoxiciclopent-2-enona (0,530 g, 1,81 mmoles) en furano (40 ml) a temperatura ambiente se añade mediante una bomba de jeringa durante dos horas una disolución de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (0,540 ml, 3,62 mmoles) en furano (10 ml). La reacción se agita a temperatura ambiente durante otros 30 minutos, y después se evapora hasta sequedad a presión reducida. El residuo se diluye con agua (50 ml), se añade ácido clorhídrico acuoso 2 M (25 ml), y la mezcla se extrae con acetato de etilo (3 x 50 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavan con salmuera (20 ml), se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora hasta sequedad a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*RS*,6*SR*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona.

10

15

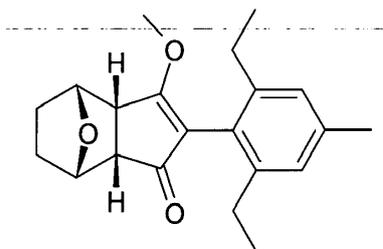
RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,90 (2H, s), 6,45 (1 H, dd), 6,35 (1 H, dd), 5,30 (1 H, d), 5,25 (1 H, d), 3,65 (3H, s), 3,65 (1 H, dd), 3,45 (1 H, dd), 2,35 (4H, m), 2,30 (3H, s), 1,10 (6H, m).

20

Nota: También se forma durante el transcurso de esta reacción una cantidad de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona.

Ejemplo 3

Preparación de (1*RS*,2*RS*,6*SS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-4-en-3-ona.



25

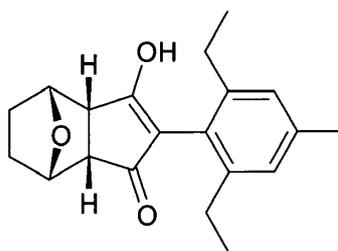
A una disolución de (1*RS*,2*RS*,6*SR*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona (0,052 g, 0,16 mmoles) en metanol (10 ml) se añade paladio al 5% sobre carbono (10 mg). La reacción se agita en una atmósfera de hidrógeno durante 90 minutos. La reacción se filtra a través de tierra de diatomeas, y la almohadilla del filtro se lava con acetato de etilo (10 ml). El disolvente se elimina a presión reducida para producir (1*RS*,2*RS*,6*SR*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-4-en-3-ona.

30

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,90 (2H, m), 4,85 (2H, m), 3,70 (3H, s), 3,60 (1 H, m), 3,35 (1 H, dd), 2,50 (2H, m), 2,35 (2H, m), 2,30 (3H, s), 1,90-1,75 (4H, m), 1,20 (3H, t), 1,10 (3H, t).

Ejemplo 4

Preparación de (1*RS*,2*RS*,6*SS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

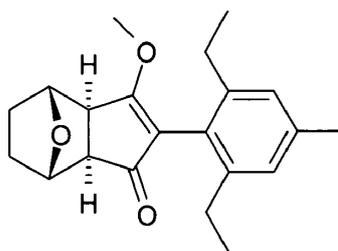


5 A una disolución de (1RS,2RS,6SR,7SR)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3-ona (0,049 g, 0,15 mmoles) en THF (1 ml) en un vial de microondas de 5 ml se añade ácido clorhídrico acuoso 2 M (4 ml). La mezcla de reacción se pone a 140°C bajo irradiación de microondas durante 50 minutos. La mezcla de reacción se enfría hasta la temperatura ambiente, se diluye con disolución acuosa 2 M de carbonato de potasio (20 ml), y se lava con éter dietílico (2 x 5 ml). El pH de la fase acuosa se ajusta a aprox. 2 mediante adición de ácido clorhídrico acuoso 5 M, y después se extrae con acetato de etilo (3 x 10 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavan con salmuera (10 ml), se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora hasta sequedad a presión reducida para dar un aceite amarillo. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1RS,2RS,6SS,7SR)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

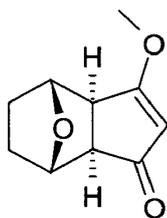
10 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,95 (2H, s), 4,75 (2H, br), 3,40 (2H, br), 2,45 (2H, q), 2,35 (2H, q), 2,30 (3H, s), 1,80 (4H, m), 1,15 (3H, t), 1,05 (3H, t).

Ejemplo 5

15 Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3-ona.

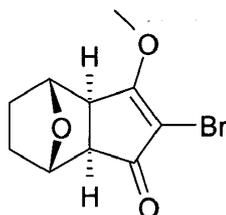


Etapa 1: Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR)-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3-ona.



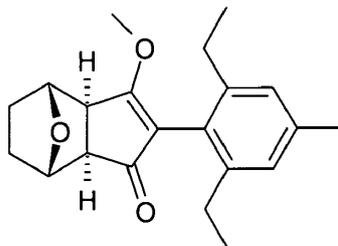
20 Se añade yodo (0,10 g, 0,38 mmoles) a una disolución de (1RS,2SR,6RS,7SR)-10-oxa-triciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (2,1 g, 12,65 mmoles) en metanol (50 ml), y la mezcla de reacción se agita durante 2 horas a temperatura ambiente. El disolvente se elimina entonces a presión reducida, se añade diclorometano, y la capa orgánica se lava con disolución acuosa saturada de tiosulfato de sodio, con agua y salmuera. La capa orgánica se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar (1RS,2SR,6RS,7SR)-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3-ona, y se usa sin purificación adicional en la etapa siguiente.

25 Etapa 2: Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-bromo-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3-ona.



Una disolución de bromo (0,14 ml, 2,8 mmoles) en diclorometano (5 ml) se añade gota a gota a una disolución del éter enólico (0,48 g, 2,6 mmoles) preparado en la etapa 1 en diclorometano (40 ml) a 0°C, y la mezcla de reacción se agita durante 1 hora. Después se añade trietilamina (0,64 ml, 4,6 mmoles), y la mezcla de reacción se deja calentar hasta la temperatura ambiente y después se agita durante 3 horas. La mezcla de reacción se lava con ácido clorhídrico acuoso 2M y con salmuera, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-bromo-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-4-en-3-ona.

Etapla 3: Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-4-en-3-ona.

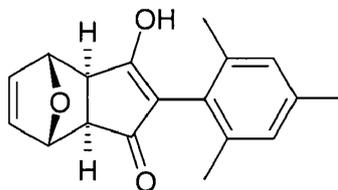


Una mezcla de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-bromo-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-4-en-3-ona (0,315 g, 1,2 mmoles), ácido 2,6-dietil-4-metilfenilborónico (0,35 g, 1,8 mmoles), 2-diciclo-hexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo (20 mg, 0,048 mmoles), acetato de paladio (II) (5,5 mg, 0,024 mmoles) y fosfato de potasio (0,51 g, 2,4 mmoles) se calienta en tolueno desgasificado a 95°C durante 24 horas. La mezcla de reacción se reparte entre diclorometano y agua, y la fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-5-metoxi-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-4-en-3-ona.

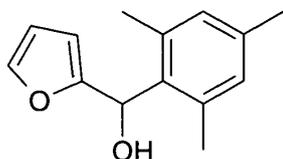
RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,90 (1 H, s), 6,80 (1 H, s), 4,73 (1 H, d), 4,66 (1 H, d), 3,58 (3H, s), 2,91 (1 H, d), 2,66 (1 H, d), 2,50 - 2,36 (4H, m), 2,30 (3H, s), 1,88 -1,81 (2H, m), 1,62 - 1,56 (2H, m), 1,12 - 1,09(6H, m).

Ejemplo 6

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

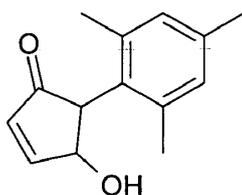


Etapla 1: Preparación de (2,4,6-trimetilfenil)furan-2-ilmetanol.



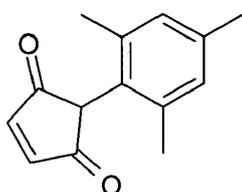
Una disolución de 2,4,6-trimetil-1-bromobenceno (30,9 g, 155 mmoles) en tetrahidrofurano (100 ml) se añade lentamente a limaduras de magnesio (3,77 g, 155 mmoles), hasta que se cubre el magnesio. Se añade una pequeña cantidad de yodo, y la mezcla se deja reposar a temperatura ambiente durante 25 minutos, y después se calienta y se agita hasta que desaparece el color marrón. El resto de la disolución de bromuro de arilo se añade gota a gota durante un período de 20 minutos, con calentamiento ocasional para mantener la formación de la disolución del reactivo de Grignard. La reacción se agita a temperatura ambiente durante 1 hora. Se añade gota a gota una disolución de furfural (12,8 ml, 155 mmoles) en tetrahidrofurano (70 ml), y una vez que la adición está terminada, la reacción se agita a temperatura ambiente durante 2 horas. La reacción se paraliza mediante adición cuidadosa de disolución saturada de cloruro de amonio en exceso, después se extrae en acetato de etilo, se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y se concentra a presión reducida. La purificación mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice proporciona (2,4,6-trimetilfenil)furan-2-ilmetanol.

Etapla 2: Preparación de 5-(2,4,6-trimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona.



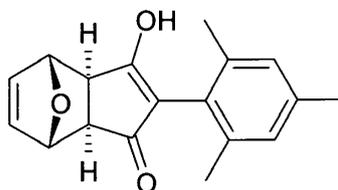
Una disolución de (2,4,6-trimetilfenil)furan-2-ilmetanol (27,8 g, 129 mmoles) en acetona (730 ml) y agua (100 ml) se calienta hasta 55°C, y se añade ácido polifosfórico (2 g). La mezcla se agita a 55°C durante 7 horas, y después se enfría hasta la temperatura ambiente toda la noche. La mezcla de reacción se concentra a presión reducida para eliminar la mayoría de la acetona, después se añade acetato de etilo (500 ml) y la mezcla de reacción se reparte. La fase acuosa se extrae en acetato de etilo, y las disoluciones orgánicas se combinan, se lavan con disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5-(2,4,6-trimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona.

10 Etapa 3: Preparación de 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona.



15 Se añade gota a gota, durante 40 minutos, reactivo de Jones (138 ml de una disolución 1,67 M, 230 mmoles) a una disolución enfriada (baño de hielo) de 5-(2,4,6-trimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (49,66 g, 230 mmoles) en acetona (600 ml). La mezcla se agita durante 1 hora. Se añade isopropanol (100 ml), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla se diluye con acetato de etilo y se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona.

Etapa 4: Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

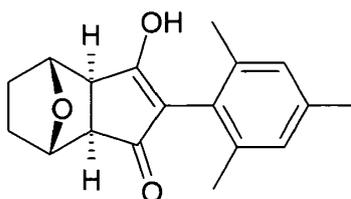


20 Se añaden furano (214 ml, 3,15 moles) y yoduro de magnesio (7,0 g, 0,025 moles) a 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (27,0 g, 0,126 moles), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 4 días. La mezcla de reacción se concentra a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

25 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,86 (2H, s), 6,47 (2H, s), 5,01 (2H, s), 2,74 (2H, s), 2,23 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo 7

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



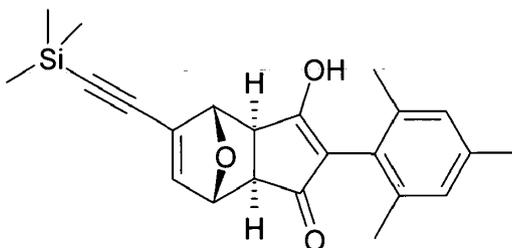
30 Una disolución de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (205 mg, 0,66 mmoles) en metanol (250 ml) se hidrogena a 2 bares sobre paladio al 5% sobre carbono (aproximadamente 20 mg) durante 1 hora a temperatura ambiente. El catalizador se elimina mediante filtración a través de tierra de

diatomeas, y el disolvente se evapora a presión reducida. La trituración con éter dietílico da (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, d₄-MeOH) δ_H 6,88 (2H, s), 4,61 (2H, s), 2,87 (2H, s), 2,27 (3H, s), 2,06 (6H, s), 1,84 - 1,82 (2H, m), 1,71 - 1,66 (2H, m).

5 Ejemplo 8

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*RS*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-8-trimetilsililetinil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

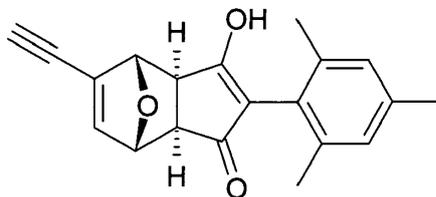


10 Se añaden 3-(trimetilsililetinil)furano (10,0 g, 61 mmoles) y yoduro de magnesio (1,11 g, 4 mmoles) a 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (4,34 g, 20 mmoles), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 3 días. La mezcla de reacción se concentra a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*RS*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-8-trimetilsililetinil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,65 (2H, s), 6,26 (1 H, s), 4,75 (1 H, s), 4,67 (1 H, s), 2,62 (1 H, d), 2,52 (1 H, d), 2,03 (3H, s), 1,84 (3H, s), 1,80 (3H, s), 0,00 (9H, s).

15 Ejemplo 9

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*RS*)-8-etinil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

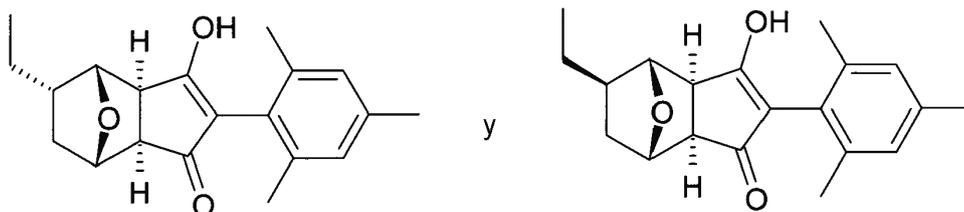


20 Se añade carbonato de potasio (2,58 g, 19 mmoles) a una disolución agitada de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*RS*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-8-trimetilsililetinil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (6,43 g, 17 mmoles) en metanol (100 ml). La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 2 horas y 30 minutos, después se añade ácido clorhídrico acuoso diluido, y la mezcla se extrae con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*RS*)-8-etinil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

25 RMN ¹H (400 MHz, d₄-MeOH) δ_H 6,85 (2H, s), 6,72 (1 H, d), 5,03 (1 H, d), 3,96 (1 H, s), 2,92 - 2,88 (2H, m), 2,24 (3H, s), 2,06 (3H, s), 2,01 (3H, s).

Ejemplo 10

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-8-etil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona y (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*SR*)-8-etil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



30 Una disolución de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*RS*)-8-etinil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (1,0 g, 3,3 mmoles) en metanol (100 ml) y diclorometano (100 ml) se hidrogena a 3,5 bares sobre paladio al 5% sobre carbono (aproximadamente 50 mg) hasta que se juzga que la reacción está terminada mediante espectrometría de masas. El catalizador se elimina mediante filtración a través de tierra de diatomeas, y el disolvente se evapora a

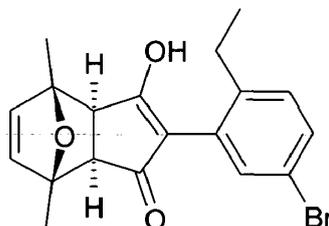
presión reducida. La purificación mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice da una mezcla aproximadamente 1:1 de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-8-etil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona y (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*SR*)-8-etil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

5 (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-8-etil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona: RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,82 (2H, s), 4,44 (1 H, d), 4,24 (1 H, s), 2,45 - 2,40 (2H, m), 2,22 (3H, s), 2,02 (6H, s), 1,58 - 1,52 (2H, m), 1,38 - 1,33 (1 H, m), 1,25 - 1,16 (2H, m), 0,85 - 0,82 (3H, m).

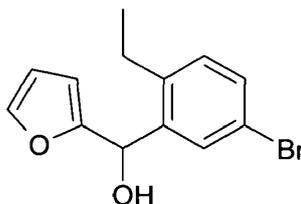
(1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*SR*)-8-etil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona: RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,85 (2H, s), 4,51 (1 H, d), 4,43 (1 H, d), 3,07 (1 H, d), 2,82 - 2,81 (1 H, m), 2,24 (3H, s), 2,10 - 2,05 (2H, m), 2,04 (6H, s), 1,87 - 1,79 (1 H, m), 1,53 - 1,46 (2H, m), 1,00 (3H, t).

10 Ejemplo 11

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-1,7dimetil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

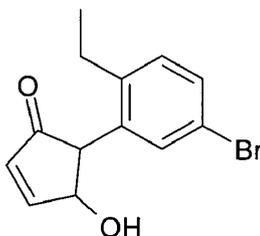


Etapa 1: Preparación de (5-bromo-2-etilfenil)furan-2-ilmetanol



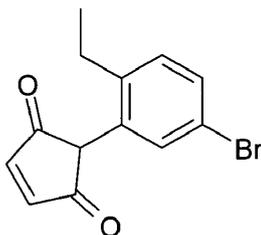
15 Se disuelve 4-bromo-2-yodoetilbenceno (50,0 g, 0,161 moles) en tetrahidrofurano anhidro (250 ml) y se enfría hasta -70°C en una atmósfera de nitrógeno. Se añade gota a gota cloruro de isopropilmagnesio (disolución 2 M en THF, 100 ml, 0,200 mmoles) con agitación vigorosa durante 40 minutos, manteniendo la temperatura interna por debajo de -60°C mediante enfriamiento externo. Cuando la adición está terminada, la reacción se agita a -70°C durante 20 minutos, y después se deja calentar hasta la temperatura ambiente durante 1 hora y 20 minutos. La mezcla de
20 reacción se enfría entonces hasta -70°C, y se añade gota a gota durante 40 minutos una disolución de 2-furaldehído (16 ml, 18,6 g, 190 mmoles) en tetrahidrofurano (50 ml). A la finalización de la adición, la reacción se deja calentar hasta la temperatura ambiente y se agita a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añade disolución acuosa saturada de cloruro de amonio (~500 ml), y la mezcla se extrae en acetato de etilo. Las disoluciones orgánicas se combinan, se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentran a presión reducida.
25 El residuo se purifica posteriormente mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (5-bromo-2-etilfenil)-furan-2-ilmetanol.

Etapa 2: Preparación de 5-(5-bromo-2-etilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona.



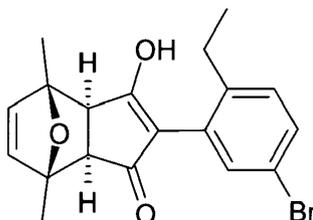
30 Una disolución de (5-bromo-2-etilfenil)furan-2-ilmetanol (40,73 g, 0,145 moles) en acetona (1150 ml) y agua (170 ml) se calienta hasta 55°C, y se añaden 30 gotas de ácido polifosfórico. La mezcla se agita a 55°C durante 44 horas, después se enfría hasta la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentra a presión reducida para eliminar la mayoría de la acetona, después se añade acetato de etilo (500 ml), y la mezcla de reacción se reparte. La fase acuosa se extrae en acetato de etilo, y las disoluciones orgánicas se combinan, se lavan con disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se
35 concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5-(5-bromo-2-etilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona.

Etapa 3: Preparación de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona.



Se añade gota a gota durante 30 minutos reactivo de Jones (75 ml de una disolución 1,67 M, 125 mmoles) a una disolución enfriada (baño de hielo) de 5-(5-bromo-4-etilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (33 g, 117 mmoles) en acetona (400 ml). La mezcla se agita durante 20 minutos, después se elimina el baño de enfriamiento, y la mezcla se agita durante 1 hora a temperatura ambiente. Se añade isopropanol (150 ml) a la suspensión amarilla, y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla se diluye con acetato de etilo y se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona.

Etapa 4: Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-1,7-dimetil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

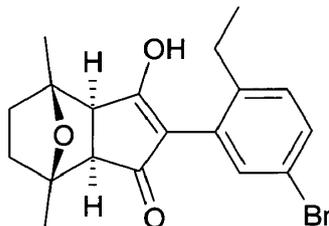


Se añaden 2,5-dimetilfurano (2,3 ml, 21,6 mmoles) y yoduro de magnesio (0,40 g, 1,4 mmoles) a una disolución de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (2,0 g, 7,2 mmoles) en diclorometano (10 ml), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 3 días. La mezcla de reacción se concentra a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-1,7-dimetil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, d₄-MeOH) δ_H 7,39 (1 H, dd), 7,18 (1 H, d), 7,16 (1 H, d), 6,35 (2H, s), 2,79 (2H, s), 2,46 (2H, q), 1,61 (6H, s), 1,07 (3H, t).

Ejemplo 12

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-1,7-dimetil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

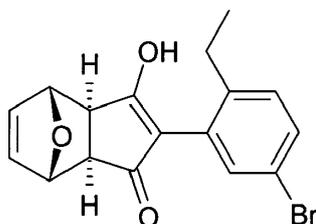


Una disolución de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-1,7-dimetil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (1,63 g, 4,3 mmoles) en metanol (200 ml) se hidrogena a 3,5 bares sobre paladio al 5% sobre carbono durante 1 hora y 30 minutos a temperatura ambiente. El catalizador se elimina mediante filtración a través de tierra de diatomeas, y el disolvente se evapora a presión reducida. La trituración con éter dietílico da (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-1,7-dimetil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, d₄-MeOH) δ_H 7,36 (1 H, dd), 7,17 (1 H, d), 7,15 (1 H, d), 2,81 (2H, s), 2,48 - 2,43 (2H, m), 1,84 - 1,79 (2H, m), 1,69 - 1,65 (2H, m), 1,51 (6H, s), 1,08 (3H, t).

Ejemplo 13

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

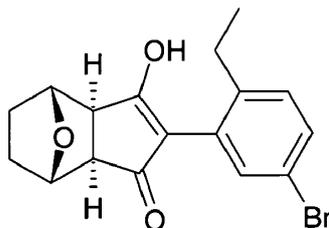


Se añaden furano (4,0 ml, 55,0 mmoles) y yoduro de magnesio (1,00 g, 3,6 mmoles) a una disolución de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona (5,0 g, 17,9 mmoles) en diclorometano (20 ml), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 3 días. Se añade una cantidad adicional de furano (1,3 ml, 17,8 mmoles) y la agitación se continúa durante 18 horas, y después se añade una cantidad adicional de furano (1,3 ml, 17,8 mmoles), y la mezcla se agita durante 48 horas, y después se deja reposar a temperatura ambiente durante 5 días. La mezcla de reacción se disuelve en metanol y se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

5 RMN ¹H (400 MHz, d₄-MeOH) δ_H 7,37 (1 H, dd), 7,17 (1 H, d), 7,14 (1 H, d), 6,54 (2H, s), 4,96 (2H, s), 2,79 (2H, s), 2,44 (2H, q), 1,06 (3H, t)

Ejemplo 14

Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

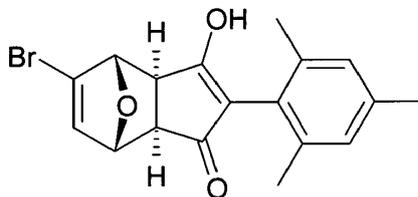


15 Una disolución de (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (3,00 g, 8,6 mmoles) en metanol (250 ml) se hidrogena a 3,5 bares sobre paladio al 5% sobre carbono durante 2 horas a temperatura ambiente. El catalizador se elimina mediante filtración a través de tierra de diatomeas, y el disolvente se evapora a presión reducida para dar (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(5-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

20 RMN ¹H (400 MHz, d₄-MeOH) δ_H 7,34 (1 H, dd), 7,15 (2H, d), 4,59 (2H, s), 2,78 (2H, s), 2,43 (2H, q), 1,81 - 1,78 (2H, m), 1,66 - 1,61 (2H, m), 1,06 (3H, t).

Ejemplo 15

Preparación de (1RS,2RS,6SR,7SR)-8-bromo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

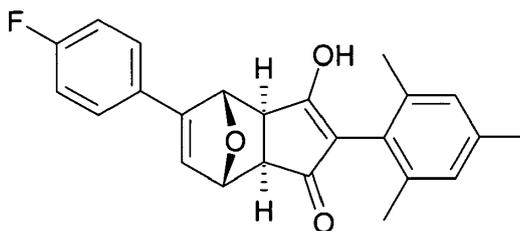


25 Se añaden 3-bromofurano (5,2 g, 56 mmoles) y yoduro de magnesio (1,5 g, 5,6 mmoles) a 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (4,0 g, 18,7 mmoles), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 2 días; se añaden pequeñas cantidades de diclorometano según requieran para ayudar a la agitación. La mezcla de reacción se deja reposar a temperatura ambiente durante 17 horas, después se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1RS,2RS,6SR,,7SR)-8-bromo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

30 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,87 (2H, s), 6,40 (1 H, d), 4,95 (1 H, s), 4,82 (1 H, s), 2,90 (1 H, d), 2,81 (1 H, d), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo 16

Preparación de (1RS,2SR,6RS,7RS)-8-(4-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5,2,10^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

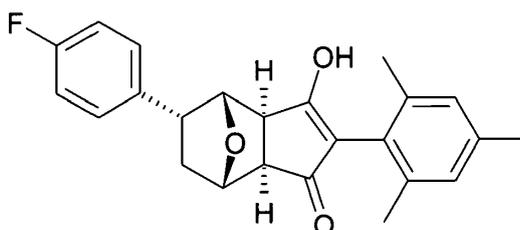


Una mezcla de (1RS,2RS,6SR,7SR)-8-bromo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (300 mg, 0,82 mmoles), ácido 4-fluorofenilborónico (171 mg, 1,22 mmoles), 2'-diclohexilfosfino-2,6-dimetoxi-1,1'-bifenil-3-sulfonato de sodio hidratado (17 mg, 0,03 mmoles), fosfato de potasio (522 mg, 2,5 mmoles) y acetato de paladio (4 mg, 0,02 mmoles) en agua (8 ml) se calientan a 150°C durante 25 minutos bajo irradiación de microondas. La mezcla se enfría hasta la temperatura ambiente y se añade ácido clorhídrico acuoso diluido. La mezcla se filtra, y el filtrado se extrae con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a presión reducida. La purificación mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice da (1RS,2SR,6RS,7RS)-8-(4-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 7,35 - 7,32 (2H, m), 6,86 (1 H, s), 6,85 (1 H, s), 6,82 - 6,77 (2H, m), 6,37 (1 H, d), 5,31 (1H, s), 5,03 (1 H, d), 2,82 - 2,78 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo 17

Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR,8SR)-8-(4-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5,2,1,10^{2,6}]decan-3,5-diona.

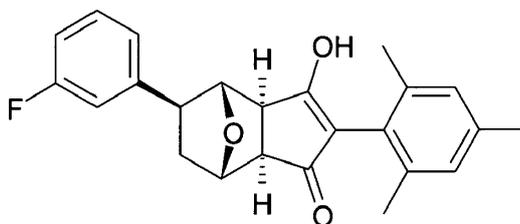


Una suspensión de (1RS,2SR,6RS,7RS)-8-(4-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (99 mg, 0,26 mmoles) en metanol (20 ml) se hidrogena a 3 bares sobre paladio al 5% sobre carbono durante 5 horas a temperatura ambiente. El catalizador se elimina mediante filtración a través de tierra de diatomeas, y el disolvente se evapora a presión reducida para dar (1RS,2SR,6RS,7SR,8SR)-8-(4-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 7,39 (2H, dd), 7,11 (2H, t), 6,86 (1H, s), 6,85 (1 H, s), 4,73 (1 H, d), 4,68 (1 H, d), 3,63 - 3,58 (1 H, m), 2,94 (1 H, d), 2,75 (1 H, d), 2,38 - 2,30 (1 H, m), 2,25 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,92 (1 H, dd).

Ejemplo 18

Preparación de (1RS,2SR,6RS,7SR,8RS)-8-(3-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



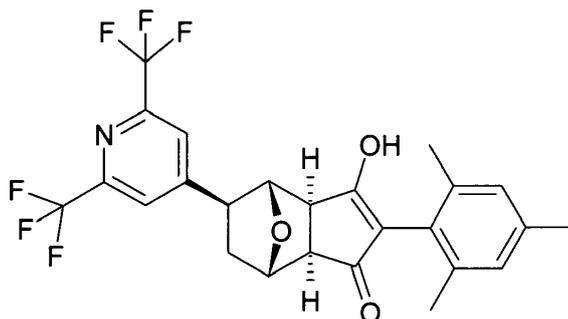
Se añaden diacetato de bis(trifenilfosfina)paladio (20 mg, 0,024 mmoles), 1-fluoro-3-yodo-benceno (104 mg, 0,47 mmoles) y piperidina (0,16 ml, 1,6 mmoles) a una disolución de (1RS,2SR,6RS,7SR)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (0,20 g, 0,71 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida seca (2 ml). Se añade ácido fórmico (0,06 ml, 1,6 mmoles), y la mezcla de reacción se calienta a 50°C durante 2 horas. La mezcla de reacción se enfría hasta la temperatura ambiente, se añaden agua (1 ml) y diclorometano (1 ml), y la mezcla se agita durante 1 hora. Las dos fases se separan, la fase orgánica se recoge, y el disolvente se evapora. El residuo se purifica

mediante HPLC de fase inversa preparativa para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-8-(3-fluorofenil)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 7,75 - 7,66 (1 H, m), 7,25 - 7,21 (1 H, m), 7,06 - 7,02 (2H, m), 6,88 (1 H, s), 6,87 (1 H, s), 4,83 (1 H, br. s), 4,59 (1 H, s), 3,00 - 2,98 (1 H, m), 2,83 - 2,70 (2H, br. s), 2,25 (3H, s), 2,20 - 2,16 (1 H, m), 2,09 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,92 - 1,89 (1 H, m).

Ejemplo 19

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-8-[2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-il]-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona

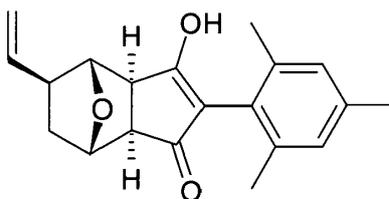


Una mezcla de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (400 mg, 1,4 mmoles), 2,6-bis(trifluorometil)-4-cloropiridina (531 mg, 1,4 mmoles), acetato de paladio (16 mg, 0,07 mmoles), 2'-diciclohexilfosfino-2,6-dimetoxi-1,1'-bifenilo (67 mg, 0,14 mmoles), formiato de potasio (353 mg, 4,2 mmoles), cloruro de tetrabutilamonio (389 mg, 1,4 mmoles) y yoduro de cobre (53 mg, 0,28 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida seca (6 ml) se calienta a 150°C durante 30 minutos bajo irradiación de microondas. La purificación mediante HPLC de fase inversa preparativa da (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-8-[2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-il]-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz d₄-MeOH) δ_H 7,81 (1 H, s), 7,26 (1 H, s), 6,92 (1 H, s), 6,90 (1 H, s), 4,91 (1 H, d), 4,64 (1 H, s), 3,19 - 3,17 (1 H, m), 2,99 - 2,95 (2H, m), 2,32 - 2,27 (1 H, m), 2,26 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,93 - 1,90 (1 H, m).

Ejemplo 20

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-8-vinil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

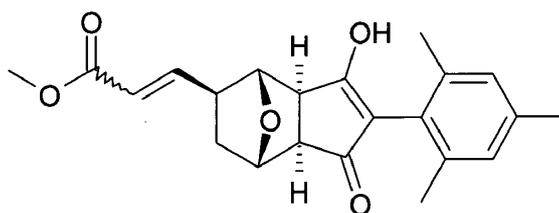


Una mezcla de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (510 mg, 1,8 mmoles), yoduro de vinilo (280 mg, 1,8 mmoles), acetato de paladio (20 mg, 0,09 mmoles), formiato de sodio (454 mg, 5,4 mmoles) y cloruro de tetrabutilamonio (500 mg, 1,8 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida seca (15 ml) se calienta a 150°C durante 20 minutos bajo irradiación de microondas. La mezcla se enfría hasta la temperatura ambiente y se reparte entre agua y acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-8-vinil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,90 - 6,89 (2H, m), 5,80 - 5,71 (1 H, m), 5,05 - 4,97 (2H, m), 4,68 (1 H, d), 4,44 (1 H, s), 2,81 - 2,76 (2H, m), 2,51 - 2,46 (1 H, m), 2,26 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,89 - 1,84 (1 H, m), 1,67 - 1,62 (1 H, m).

Ejemplo 21

Preparación de [(1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-3,5-dioxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-il]acrilato de metilo.

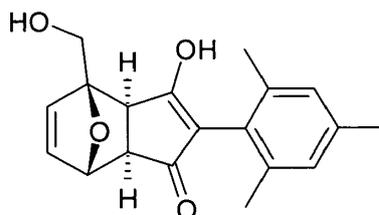


5 Se añade benciliden[1,3-bis(2,4,6-trimetilfenil)-2-imidazolidiniliden]dicloro(triciclohexilfosfina)rutenio (14 mg, 0,016 mmoles) a una suspensión de (1*RS*,2*SR*,6*RS*, 7*SR*, 8*RS*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-8-vinil-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (100 mg, 0,32 mmoles) y acrilato de metilo (0,03 ml, 0,35 mmoles) en diclorometano (1 ml), y la mezcla se agita a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se enfría hasta la temperatura ambiente, el disolvente se evapora a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar [(1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*,8*RS*)-3,5-dioxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-il]acrilato de metilo. La RMN

10 protónica indica que el producto comprende una mezcla de isómeros *E* y *Z*.
Isómero *E*: RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,80 (2H, s), 6,74 (1 H, dd), 5,91 (1 H, d), 4,58 (1 H, d), 4,30 (1 H, s), 3,33 (3H, s), 2,85 - 2,77 (3H, m), 2,21 (3H, s), 1,97 (3H, s), 194 (3H, s), 1,94 - 1,91 (1 H, m), 1,59- 1,54 (1 H, m).

Ejemplo 22

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*SR*,7*SR*)-1-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetil)-fenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

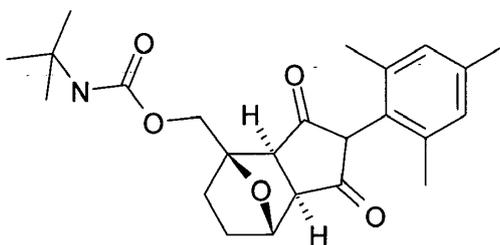


15 Se añade alcohol furfúrico (4 ml, 46,7 mmoles) a 2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-4-en-1,3-diona (2,0 g, 9,3 mmoles) y MgI₂ (520 mg, 1,86 mmoles), y la reacción se agita durante 17 horas. La mezcla de reacción se adsorbe sobre gel de sílice y se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-1-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona.

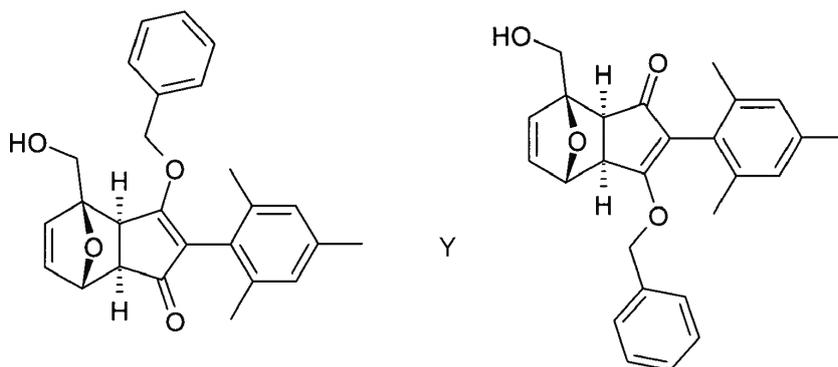
20 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,87 (2H, s), 6,49 (1 H, d), 6,44 (1 H, d), 4,96 (1 H, d), 3,98 (1 H, d), 3,85 (1 H, d), 2,82-2,78 (2H, m), 2,24 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo 23

Preparación de éster [(1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-3,5-dioxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico.

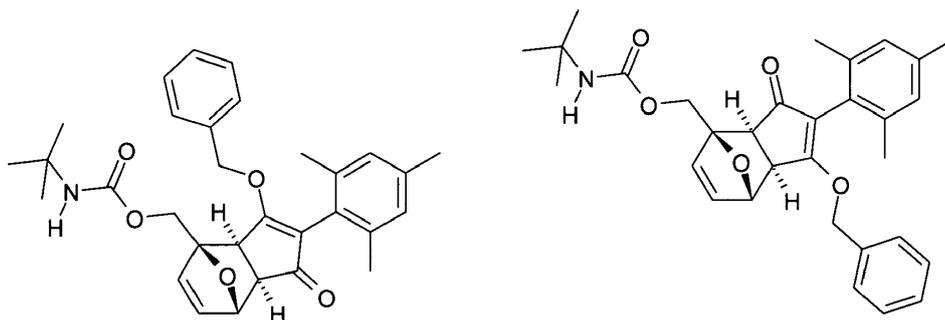


25 Etapa 1: Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*SR*,7*SR*)-5-benciloxi-7-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona y (1*RS*,2*SR*,6*SR*,7*SR*)-5-benciloxi-1-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona



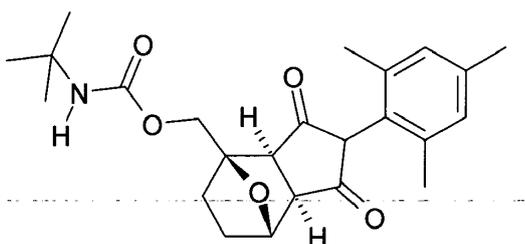
5 Se añade bromuro de bencilo (0,72 ml, 6,1 mmoles) a una mezcla de carbonato de potasio (840 mg, 6,1 mmoles) y (1RS,2SR,6RS,7SR)-1-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-3,5-diona (1,80 g, 5,8 mmoles) en acetona (80 ml), y la mezcla de reacción se calienta a reflujo durante 4 horas. La mezcla de reacción se enfría hasta la temperatura ambiente, se diluye con agua y se extrae con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar una mezcla de (1RS,2SR,6SR,7SR)-5-benciloxi-7-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona y (1RS,2SR,6RS,7SR)-5-benciloxi-1-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona.

10 Etapa 2: Preparación de éster [(1RS,2RS,6RS,7SR)-3-benciloxi-5-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico y éster [(1RS,2SR,6RS,7SR)-5-benciloxi-3-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico.



15 Se añade hidruro de sodio (60 mg, 1,97 mmoles) a una mezcla enfriada (0°C) de (1RS,2SR,6SR,7SR)-5-benciloxi-7-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona y (1RS,2SR,6RS,7SR)-5-benciloxi-1-hidroximetil-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-3-ona (265 mg, 0,66 mmoles) en tetrahidrofurano (10 ml). La mezcla se agita durante unos pocos minutos, y después se añade isocianato de *tert*-butilo (0,15 ml, 1,32 mmoles). La reacción se deja calentar hasta la temperatura ambiente y se agita durante 17 horas. La mezcla se reparte entre agua y acetato de etilo, y las disoluciones orgánicas se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se evapora. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar una mezcla de éster [(1RS,2RS,6RS,7SR)-3-benciloxi-5-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico y éster [(1RS,2SR,6RS,7SR)-5-benciloxi-3-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico.

25 Etapa 3: Preparación de éster [(1RS,2SR,6RS,7SR)-3,5-dioxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-en-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico.



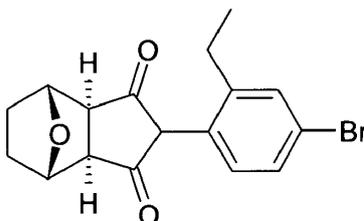
30 Una suspensión de una mezcla de éster [(1RS,2RS,6RS,7SR)-3-benciloxi-5-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-1-il]metílico y éster [(1RS,2SR,6RS,7SR)-5-benciloxi-3-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]deca-4,8-dien-1-il]metílico del ácido *tert*-butilcarbámico (147 mg, 0,29 mmoles) en metanol (20

ml) se hidrogena a 3 bares sobre paladio al 5% sobre carbono durante 5 horas. El catalizador se elimina mediante filtración, y el filtrado se concentra a presión reducida para dar éster [(1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-3,5-dioxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-8-en-1-il]metílico del ácido *terc*-butilcarbámico.

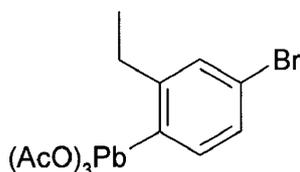
5 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,83 (2H, s), 5,02 (1 H, s), 4,72 (1 H, d), 4,65 (1 H, d), 4,12 (1 H, d), 2,83 (1 H, d), 2,70 (1 H, d), 2,23 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,86 - 1,80 (2H, m), 1,57 - 1,45 (2H, m), 1,29 (9H, s).

Ejemplo 24

Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(4-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



Etapas 1: Preparación de triacetato de 4-bromo-2-etilfenilplomo.

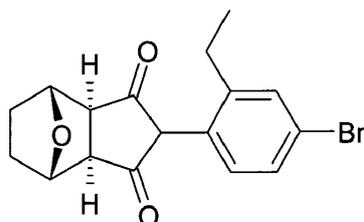


10

Se añade cloroformo seco (30 ml) a una mezcla de tetraacetato de plomo (8,52 g, 19,3 mmoles) y diacetato de mercurio (0,28 g, 0,875 mmoles) en una atmósfera de nitrógeno, y la mezcla de reacción se agita y se calienta hasta 40°C. Se añade ácido 4-bromo-2-etilfenilborónico (4,0 g, 17,5 mmoles) en una porción, y la mezcla se agita a 40°C durante 4 horas. La mezcla de reacción se enfría hasta 0°C, y se añade en porciones carbonato de potasio (2,66 g, 19,3 mmoles). La mezcla se agita durante 5 minutos, después se filtra a través de un pequeño tapón de tierra de diatomeas, lavando con cloroformo. El filtrado se concentra a presión reducida para dar triacetato de 4-bromo-2-etilfenilplomo.

15

Etapas 2: Preparación de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(4-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.



20

Se añaden 4-dimetilaminopiridina (3,67 g, 30,0 mmoles) y tolueno (10 ml) a una disolución de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona (1,0 g, 6,0 mmoles) en cloroformo (40 ml), y la mezcla de reacción se calienta hasta 80°C. Se añade triacetato de 4-bromo-2-etilfenilplomo (5,13 g, 9,04 mmoles) en porciones durante 20 minutos, y una vez que la adición está terminada, la mezcla de reacción se agita a 80°C durante otras 4 horas. La mezcla se enfría hasta la temperatura ambiente, se añade ácido clorhídrico acuoso 2 M (40 ml), y la mezcla se agita vigorosamente durante 15 minutos, después se filtra a través de un pequeño tapón de tierra de diatomeas, lavando con 40 ml de diclorometano. La fase orgánica se separa, y la fase acuosa se extrae con diclorometano (2 x 20 ml). Las disoluciones orgánicas se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(4-bromo-2-etilfenil)-10-oxatriciclo-[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona.

25

30

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 7,39 (1 H, dd), 7,27-7,33 (1 H, m), 6,97 (1 H, dd), 4,68 (2H, m), 2,74 (2H, br. s), 2,48 (2H, q), 1,78-1,87 (2H, m), 1,56 (2H, m), 1,11 (3H, t).

Se prepararon compuestos adicionales en la Tabla T1 mediante procedimientos similares usando materiales de partida apropiados. Se debería observar que ciertos compuestos de la invención existen como una mezcla de isómeros señalados anteriormente, en las condiciones usadas para obtener los datos de RMN ¹H. Cuando esto haya ocurrido, los datos caracterizantes se dan para todos los isómeros presentes a temperatura ambiente en el disolvente especificado. Excepto que se señale de otro modo, los espectros de RMN protónica se registraron a

35

temperatura ambiente. Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando uno de los dos métodos descritos más abajo.

Método A

- 5 Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando un inyector Waters 2777 con una HPLC de microbomba 1525 equipado con una columna Waters Atlantis dC18 IS (longitud de la columna 20 mm, diámetro interno de la columna 3 mm, tamaño de partículas 3 micrómetros), un conjunto de fotodiodos Waters 2996, Waters 2420 ELSD y Micromass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo usando un tiempo de experimentación de tres minutos, según la siguiente tabla de gradientes:

Tiempo (min.)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	95,0	5	1,300
2,50	0,0	100	1,300
2,80	0,00	100	1,300
2,90	95,0	5	1,300

Disolvente A: H₂O con 0,05% de TFA
Disolvente B: CH₃CN con 0,05% de TFA

10 Método B

Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando una HPLC Waters 2795 equipada con una columna Waters Atlantis dC18 IS (longitud de la columna 20 mm, diámetro interno de la columna 3 mm, tamaño de partículas 3 micrómetros, temperatura 40°C), un conjunto de fotodiodos Waters, y Micromass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo usando un tiempo de experimentación de tres minutos, según la siguiente tabla de gradientes:

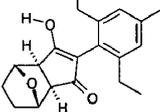
Tiempo (min.)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	90,0	10,0	2,00
0,25	90,0	10,0	2,00
2,00	10,0	90,0	2,00
2,50	10,0	90,0	2,00
2,60	90,0	10,0	2,00
3,0	90,0	10,0	2,00

Disolvente A: H₂O que contiene 0,1% de HCOOH
Disolvente B: CH₃CN que contiene 0,1% de HCOOH

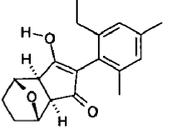
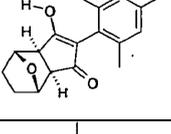
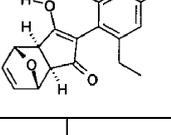
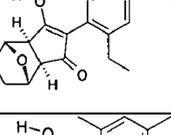
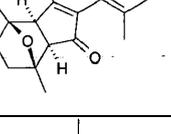
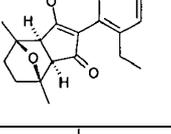
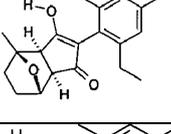
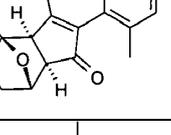
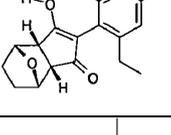
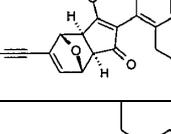
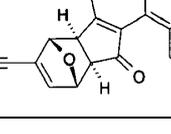
15

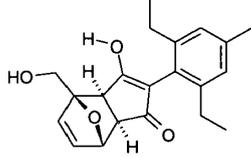
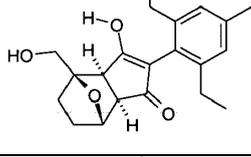
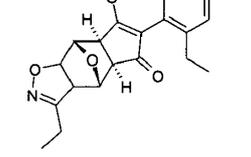
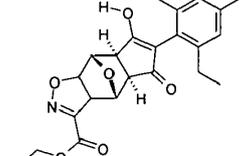
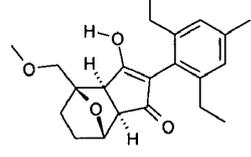
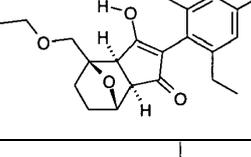
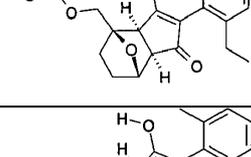
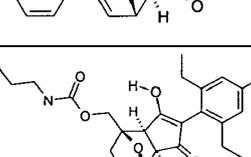
Los valores característicos obtenidos para cada compuesto fueron el tiempo de retención (rt, registrado en minutos) y el ion molecular (típicamente el catión MH⁺), como se da en la Tabla T1.

Tabla T1

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T1		δ_{H} 6,88 - 6,87 (2H, m), 4,55 - 4,54 (2H, m), 2,62 (2H, s), 2,36 - 2,27 (7H, m), 1,69 - 1,67 (2H, m), 1,40 - 1,39 (2H, m), 1,03 (6H, q).

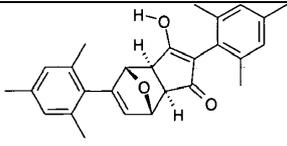
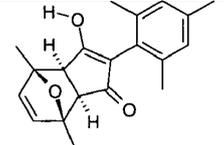
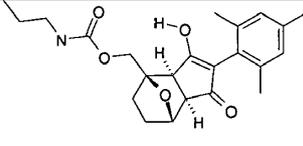
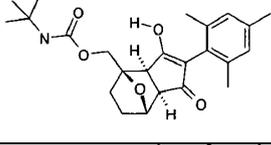
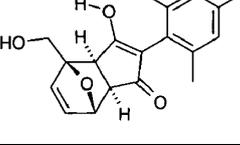
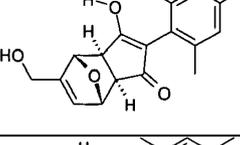
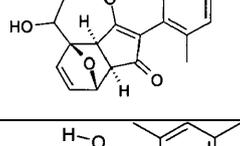
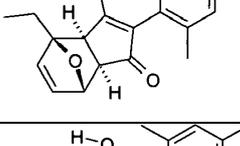
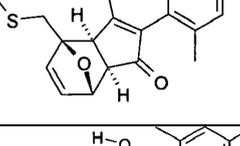
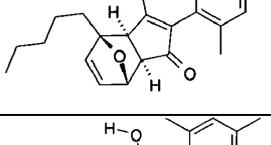
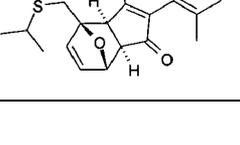
ES 2 497 501 T3

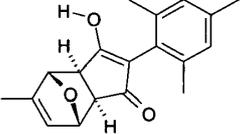
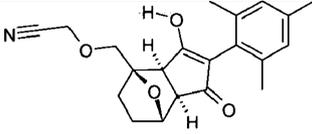
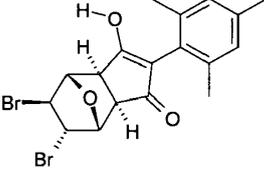
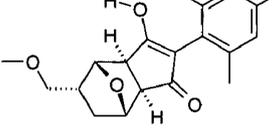
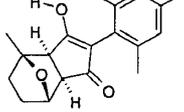
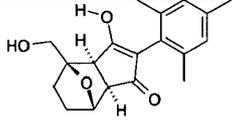
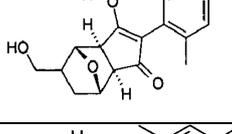
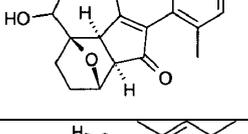
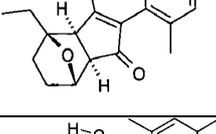
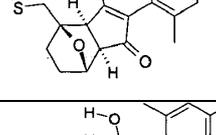
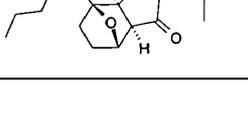
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T2		δ _H 6,88 (2H, m), 4,58 (2H, s), 2,65 (2H, m), 2,38 - 2,32 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,76 - 1,71 (2H, m), 1,45 (2H, m), 1,04 (3H, q).
T3		δ _H 6,86 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,68 - 4,67 (2H, m), 2,74 (2H, s), 2,24 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,83 - 1,80 (2H, m), 1,58 - 1,54 (2H, m).
T4		δ _H 6,94 (2H, s), 6,44 (2H, s), 5,04 (2H, s), 2,81-2,73 (2H, m), 2,41 - 2,35 (4H, m), 2,30 (3H, s), 1,10 - 1,02 (6H, m).
T5		δ _H 6,94 (1H, s), 6,93 (1H, s), 4,64 - 4,63 (2H, m), 2,73 (2H, s), 2,59 (2H, q), 2,41 - 2,31 (4H, m), 1,77 (2H, m), 1,48 (2H, m), 1,22 (3H, t), 1,06 (6H, m).
T6		δ _H 6,98 (1H, s), 6,97 (1H, s), 2,64 - 2,59 (2H, brs), 2,25 (3H, s), 2,03 (6H, s), 1,66 (4H, s), 1,50 (6H br s).
T7		δ _H 6,95 (1H, s), 6,47 (1H, br s), 3,00 (1H, d), 2,68 - 2,66 (1H, m), 2,44 - 2,31 (7H, m), 1,77 - 1,71 (4H, m), 1,58 (3H, s), 1,55 (3H, s), 1,08 (6H, q).
T8		δ _H 6,95 (s), 4,69 (d), 4,64 (d), 3,05 (d), 2,91 (d), 2,81 (d), 2,59 (d), 2,44 - 2,32 (m), 2,31 (s), 2,00 - 1,93 (m), 1,67 - 1,62 (m), 1,61 (s), 1,58 (s), 1,10 - 1,05 (m).
T9		δ _H 6,92 (2H, s), 6,47 (1H, s), 6,32 (0,5H, s), 6,28 (0,5H, s), 5,14 (0,5H, s), 4,97 (0,5H, br s), 3,06 (0,5H, br s), 2,86 (0,5H, s), 2,80 (0,5H br s), 2,50 (0,5H, br s), 2,28 (3H, s), 2,12 (6H, s), 1,70 (3H, br s).
T10		δ _H 6,95 (2H, s), 4,75 (2H, br), 3,40 (2H, br), 2,45 (2H, q), 2,35 (2H, q), 2,30 (3H, s), 1,80 (4H, m), 1,15 (3H, t), 1,05 (3H, t).
T11		δ _H 6,70 (2H, s), 6,24 (1H, s), 4,79 (1H, s), 4,73 (1H, s), 2,67 (1H, br s), 2,56 (1H, d), 2,17 - 2,08 (7H, m), 0,87 - 0,77 (6H, m), 0,00 (9H, s).
T12		δ _H 6,94 (2H, s), 6,66 (0,5H, s), 6,62 (0,5H, s), 5,14 - 5,02 (2H, m), 3,42 (1H, s), 3,10 (0,5H, s), 3,00 (0,5H, s), 2,86 (0,5H, s), 2,77 (0,5 H, s), 2,38 - 2,31 (7H, m), 1,10 - 1,01 (6H, m).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T13		δ_H 6,95 (2H, s), 6,60 (1H, s), 6,53 - 6,51 (1H, m), 5,07 (1H, s), 4,14 - 4,00 (2H, m), 3,10 - 2,90 (br m, 2H), 2,42 - 2,28 (7H, m), 1,11 - 1,04 (6H, m).
T14		δ_H 6,88 (2H, s), 4,57 (1H, d), 3,86 (1H, d), 3,73 (1H, d), 3,23 (1H, s), 2,35 - 2,27 (7H, m), 1,86 - 1,53 (4H, m), 1,06 - 1,00 (6H, m).
T15		δ_H 6,94 (1H, s), 6,93 (1H, s), 4,86 (1H, s), 4,79 (1H, d), 4,76 (1H, s), 3,50 (1H, d), 2,96 (1H, s), 2,78 (1H, s), 2,50 - 2,25 (9H, m), 1,24 - 1,18 (3H, m), 1,09 - 1,02 (6H, m).
T16		δ_H 6,92 (2H, s), 5,00 (1H, d), 4,96 (1H, s), 4,93 (1H, s), 4,37 - 4,32 (2H, m), 3,78 (1H, d), 2,96 (1H, s), 2,61 (1H, s), 2,34 - 2,30 (7H, m), 1,39 - 1,35 (3H, m), 1,07 - 1,00 (6H, m).
T17		δ_H 8,40 (1H, s), 6,93 (1H, s), 6,92 (1H, s), 4,78 (1H, d), 4,01 (1H, d), 3,75 (1H, d), 3,52 (3H, s), 3,11 (1H, d), 2,81 (1H, d), 2,44 - 2,31 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,00 - 1,93 (2H, m), 1,75 - 1,70 (2H, m), 1,09 - 1,05 (6H, m).
T18		δ_H 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,66 (1H, d), 3,94 (1H, d), 3,77 (1H, d), 3,65 - 3,52 (2H, m), 2,88 (1H, s), 2,80 (1H, d), 2,39 - 2,26 (7H, m), 1,94 - 1,90 (2H, m), 1,65 - 1,60 (4H, m), 1,20 (3H, t), 1,05 - 1,00 (6H, m).
T19		δ_H 6,92 (1H, s), 6,91 (1H, s), 4,75 (2H, s), 4,69 (1H, s), 4,04 - 3,96 (2H, m), 3,64 - 3,61 (2H, m), 2,94 (1H, br s), 2,81 (1H, d), 2,42 - 2,30 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,00 - 1,86 (2H, m), 1,69 - 1,54 (2H, m), 1,22 - 1,19 (3H, m), 1,08 - 1,04 (8H, m).
T20		δ_H 7,29 - 7,26 (2H, m), 7,05 (2H, d), 6,85 (1H, s), 6,84 (1H, s), 6,39 (1H, d), 5,32 (1H, s), 5,02 (1H, d), 2,79 - 2,75 (2H, m), 2,33 (3H, s), 3,23 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,04 (3H, s).
T21		δ_H 6,87 (2H, s), 5,44 (1H, v. br s), 4,71 - 4,64 (2H, m), 4,26 - 4,23 (1H, m), 3,11 - 3,06 (2H, m), 2,90 (1H, br s), 2,81 (1H, d), 2,38 - 2,27 (4H, m), 2,25 (3H, s), 1,93 - 1,82 (2H, m), 1,66 - 1,52 (2H, m), 1,50 - 1,43 (2H, m), 1,01 (6H, t), 0,87 (3H, t).

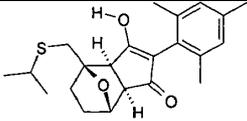
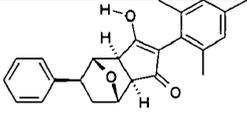
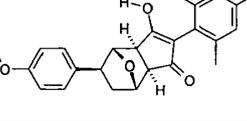
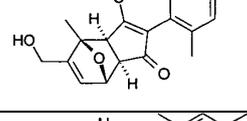
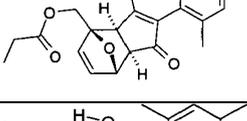
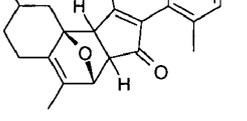
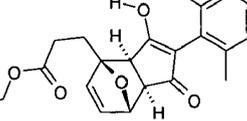
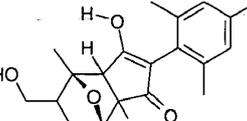
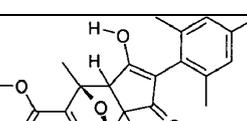
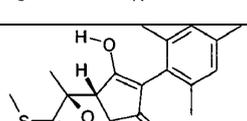
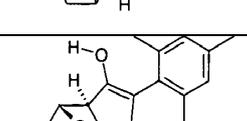
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T22		δ _H 7,21 (1H, d), 6,93 (1H, dd), 6,84 (2H, s), 6,30 (1H, s), 5,24 (1H, s), 5,04 (1H, s), 2,82 - 2,81 (1H, m), 2,78 - 2,77 (1H, m), 2,28 (3H, s con division fina) 2,22 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,04 (3H, s).
T23		δ _H 7,33 (2H, d), 6,86 - 6,81 (4H, m), 6,35 (1H, s), 5,32 (1H, s), 5,04 (1H, s), 3,80 (3H, s), 2,83 - 2,82 (1H, m), 2,77 (1H, br s), 2,24 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,05 (3H, s).
T24		δ _H 7,35 - 7,32 (2H, m), 6,86 (1H, s), 6,85 (1H, s), 6,82 - 6,77 (2H, m), 6,37 (1H, d), 5,31 (1H, s), 5,03 (1H, d), 2,82 - 2,78 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,05 (3H, s).
T25		δ _H 7,25 - 7,17 (4H, m), 6,86 (1H, s), 6,84 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,68 (1H, d), 3,61 - 3,56 (1H, m), 2,90 (1H, d), 2,80 (1H, d), 2,35 - 2,20 (4H, m), 2,24 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,92 (1H, dd).
T26		δ _H 7,38 - 7,36 (2H, m), 7,22 - 7,20 (2H, m), 6,86 (2H, s), 6,58 (1H, d), 5,38 (1H, d), 5,11 (1H, s), 2,90 (1H, m), 2,84 (1H, m), 2,47 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,08 (6H, s).
T27		δ _H 6,92 (2H, s), 4,62 (1H, d), 4,29 - 4,27 (1H, m), 4,10 - 4,03 (2H, m), 3,93 - 3,90 (1H, m), 2,84 (1H, d), 2,77 (1H, d), 2,38 - 2,29 (4H, m), 2,30 (3H, s), 1,96 - 1,88 (2H, m), 1,59 - 1,51 (2H, m), 1,07 - 1,03 (6H, m).
T28		δ _H 7,39 (2H, dd), 7,11 (2H, t), 6,86 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,68 (1H, d), 3,63 - 3,58 (1H, m), 2,94 (1H, d), 2,75 (1H, d), 2,38 - 2,30 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,92 (1H, dd).
T29		δ _H 6,82 (2H, s), 4,54 (1H, d), 3,85 (1H, d), 3,67 (1H, d), 3,30 (3H, s), 2,90 (1H, d), 2,78 (1H, d), 2,20 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,99 (3H, s), 1,93 (1H, dd), 1,87 - 1,81 (1H, m), 1,70 - 1,63 (1H, m), 1,58 - 1,54 (1H, m).
T30		δ _H 6,87 (1H, s), 6,86 (1H, s), 4,87 - 4,81 (=, m), 4,67 - 4,65 (1H, m), 4,08 - 3,93 (2H, m), 3,66 - 3,58 (2H, m), 2,89 - 2,84 (1H, m), 2,76 - 2,73 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,95 - 1,84 (2H, m), 1,71 - 1,59 (2H, m), 1,26 - 1,17 (3H, m).
T31		δ _H 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,67 (1H, t), 3,97 (1H, d), 3,81 (1H, d), 3,70 - 3,62 (1H, m), 3,60 - 3,54 (1H, m), 2,87 - 2,82 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,99 - 1,94 (2H, m), 1,69 - 1,64 (2H, m), 1,23 (3H, t).
T32		δ _H 7,20 - 7,18 (2H, m), 7,12 - 7,10 (2H, m), 6,88 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,71 (2H, t), 3,55 - 3,50 (1H, m), 2,77 (1H, d), 2,73 (1H, d), 2,48 (3H, s), 2,32 - 2,25 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,72 (1H, dd).

ES 2 497 501 T3

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T33		δ _H 6,93 (2H, s), 6,88 (2H, s), 6,36 (1H, d), 5,13 (1H, d), 5,01 (1H, s), 3,13 (1H, d), 2,96 (1H, d), 2,29 (12H, s), 2,11 (3H, s), 2,09 (3H, s).
T34		δ _H 2,82 (2H, s), 6,19 (2H, s), 2,51 (2H, br s), 2,22 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,57 (6H, s).
T35		δ _H 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,73 - 4,69 (2H, m), 4,29 (1H, d), 3,14 - 3,09 (2H, m), 2,93 (1H, d), 2,85 (1H, d), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,97 - 1,86 (2H, m), 1,71 - 1,59 (2H, m), 1,54 - 1,47 (2H, m), 0,91 (3H, t).
T36		δ _H 6,83 (2H, s), 5,02 (1H, s), 4,72 (1H, d), 4,65 (1H, d), 4,12 (1H, d), 2,83 (1H, d), 2,70 (1H, d), 2,23 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,86 - 1,80 (2H, m), 1,57 - 1,45 (2H, m), 1,29 (9H, s).
T37		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 313; rt = 1,07 min.
T38		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 313; rt = 1,07 min.
T39		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 327; rt = 1,23 min.
T40		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 311; rt = 1,34 min.
T41		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 343; rt = 1,35 min.
T42		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 353; rt = 1,79 min.
T43		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 371; rt = 1,50 min.

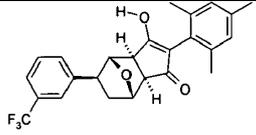
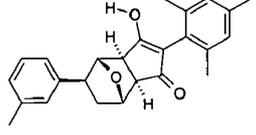
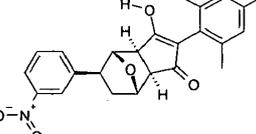
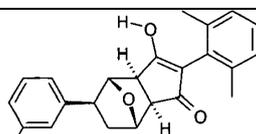
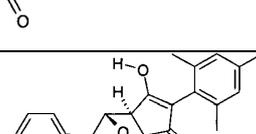
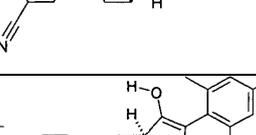
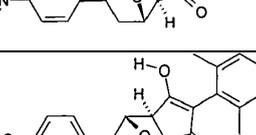
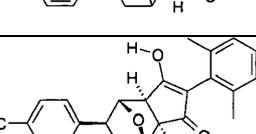
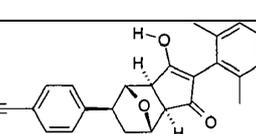
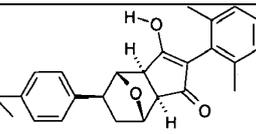
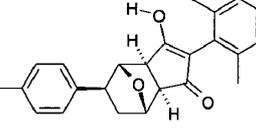
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T44		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 297; rt = 1,25 min.
T45		δ_{H} 6,86 (2H; s), 4,61 - 4,58 (2H, m), 4,43 (1H, d), 4,07 (1H, d), 3,95 (1H, d), 2,98 - 2,85 (2H, m), 2,24 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,91 - 1,87 (2H, m), 1,76 - 1,70 (1H, m), 1,65 - 1,59 (1H, m).
T46		δ_{H} 6,93 (2H, s), 4,75 (1H, d), 4,72 (1H, s), 4,38 (1H, dd), 3,93 (1H, d), 3,68 (1H, d), 2,90 (1H, d), 2,38 - 2,31 (7H, m), 1,08 - 1,01 (6H, m).
T47		δ_{H} 6,82 (2H, s), 4,50 - 4,45 (2H, m), 3,36 - 3,34 (1H, m), 3,26 - 3,24 (4H, m), 2,92 (1H, d), 2,47 (1H, d), 2,41 - 2,36 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,02 (6H, s), 1,95 - 1,88 (1H, m), 1,00 (1H, dd).
T48		δ_{H} 6,84 - 6,83 (2H, m), 4,47 (1H, d), 2,63 (1H, d), 2,41 (1H, d), 2,23 (3H, s), 2,04 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,86 - 1,83 (1H, m), 1,55 - 1,46 (3H, m), 1,48 (3H, s).
T49		δ_{H} 6,85 (2H, s), 4,55 (1H, d), 3,84 (1H, d), 3,75 (1H, d), 2,76 - 2,70 (2H, m), 2,23 (3H, s), 2,03 (6H, s).
T50		δ_{H} 6,83 - 6,82 (2H, m), 4,48 - 4,45 (2H, m), 3,35 - 3,34 (1H, m), 3,26 - 3,24 (1H, m), 2,93 (1H, d), 2,48 (1H, d), 2,23 (3H, s), 2,02 (6H, s), 2,42 - 2,36 (1H, m), 1,94 - 1,88 (1H, m), 1,01 (1H, dd).
T51		δ_{H} 6,85 (2H, s), 4,55 (1H, d), 4,03 (1H, q), 2,76 (1H, d), 2,72 (1H, d), 2,23 (3H, s), 2,04 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,84 - 1,70 (2H, m), 1,58 - 1,41 (2H, m), 1,24 (3H, d).
T52		δ_{H} 6,82 (1H, s), 6,81 (1H, s), 4,42 (1H, d), 2,53 - 2,48 (2H, m), 2,22 (3H, s), 2,00 (3H, s), 1,98 (3H, s), 1,93 - 1,86 (1 H, m), 1,77 - 1,70 (2H, m), 1,54 - 1,41 (3H, m), 1,03 (3H, t).
T53		δ_{H} 6,83 (2H, s), 4,49 (1H, d), 3,00 - 2,92 (2H, m), 2,62 - 2,58 (2H, m), 2,23 (3H, s), 2,14 (3H, s), - 2,02 (3H, s), 2,00 (3H, s), 2,00 - 1,85 (2H, m), 1,52 - 1,47 (2H, m).
T54		δ_{H} 6,84 (1H, s), 6,83 (1H, s), 4,45 (1H, d), 2,60 - 2,56 (2H, m), 2,23 (3H, s), 2,04 (3H, s), 2,00 (3H, s), 1,93 - 1,88 (1H, m), 1,80 - 1,76 (1H, m), 1,69 - 1,46 (4H, m), 1,35 - 1,26 (6H, m), 0,88 - 0,85 (3H, m).

ES 2 497 501 T3

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T55		δ_H 6,86 (2H, m), 3,11 - 3,00 (4H, m), 2,72 (1H, d), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,98 - 1,89 (1H, m), 1,79 - 1,56 (3H, m), 1,33 - 1,25 (6H, m)
T56		δ_H 7,28 - 7,17 (5H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,72 (1H, d), 4,53 (1H, s), 2,89 (1H, dd), 3,02 (1H, d), 2,96 (1H, d), 2,32 - 2,30 (1H, m), 2,27 (3H, s), 2,07 (6H, s), 1,90 - 1,85 (1H, m).
T57		δ_H 7,26 - 7,23 (2H, m), 6,88 - 6,85 (4H, m), 4,74 (1H, d), 4,40 (1H, s), 3,79 (3H, s), 3,10 (1H, dd), 3,02 (1H, d), 2,96 (1H, d), 2,32 - 2,30 (1H, m), 2,27 (3H, s), 2,07 (6H, s), 1,90 - 1,85 (1H, m).
T58		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 327; rt = 1,10 min.
T59		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 369; rt = 1,33 min.
T60		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 365; rt = 1,77 min.
T61		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 383; rt = 1,36 min.
T62		δ_H 6,86 (2H, s), 4,48 (1H, d), 3,68 - 3,48 (2H, m), 2,81 - 2,74 (1H, m), 2,67 (1H, d), 2,23 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,54 (3H, s), 1,27 - 1,26 (1H, m), 1,04 - 1,01 (2H, m).
T63		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 355; rt = 1,36 min.
T64		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 343; rt = 1,37 min.
T65		d ₄ -MeOH δ_H 6,85 (2H, m), 4,51 (1H, d), 4,37 (1H, d), 3,14 (1H, d), 2,84 (1H, d), 2,28 - 2,24 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,13 (1H, dd), 2,04 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,13 (3H, d), 1,11 - 1,06 (1H, m).

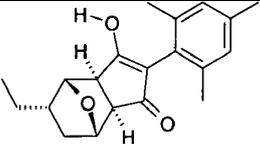
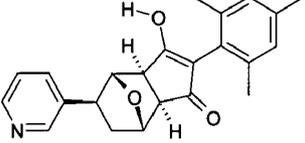
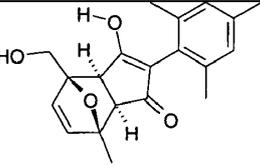
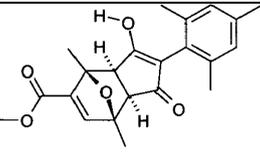
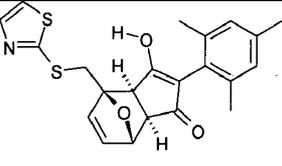
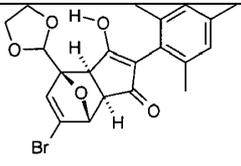
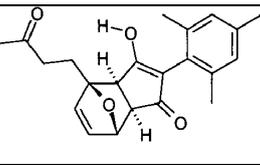
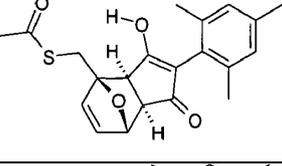
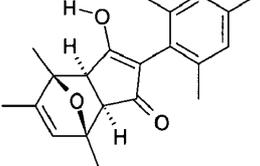
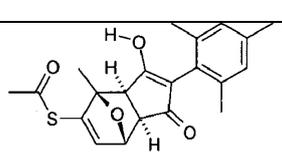
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T66		δ _H 7,26 - 7,18 (4H, m), 6,85 (2H, s), 4,72 (1H, d), 4,40 (1H, s), 3,09 (1H, dd), 3,00 (1H, d), 2,94 (1H, d), 2,44 (3H, s), 2,29 - 2,24 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,05 (6H, s), 1,88 - 1,82 (1H, m).
T67		δ _H 7,24 - 7,21 (1H, m), 6,94 - 6,93 (2H, m), 6,88 (2H, s), 4,75 (1H, d), 4,45 (1H, s), 3,52 (1H, dd), 3,05 (1H, d), 2,96 (1H, d), 2,35 - 2,29 (1H, m), 2,27 (3H, s), 2,08 (6H, s), 2,01- 1,95 (1H, m).
T68	<p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	Mezcla aproximadamente 3:2 de Isómero A: Isómero B Isómero A: δ _H 6,86 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,55 (1H, d), 4,53 (1H, d), 3,50 - 3,42 (3H, m), 3,36 - 3,33 (1H, m), 3,02 (1H, d), 2,49 - 2,43 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,05 (6H, s), 2,01 - 1,94 (1H, m), 1,19 (3H, t), 1,06 (1H, dd).
T69		δ _H 6,85 (2H, s), 4,69 (2H, s), 4,56 - 4,54 (2H, m), 3,76 - 3,55 (5H, m), 3,12 (1H, d), 2,83 (1H, d), 2,55 - 2,45 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,24 - 1,15 (4H, m).
T70		δ _H 7,34 - 7,31 (2H, m), 7,00 (2H, t), 6,85 (2H, s), 4,73 (1H, d), 4,39 (1H, s), 3,13 (1H, dd), 3,01 (1H, d), 2,95 (1H, d), 2,30 - 2,27 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,05 (6H, s), 1,87 - 1,81 (1H, m).
T71		δ _H 7,21 (2H, d), 7,11 (2H, d), 6,88 (2H, s), 4,74 (1H, d), 4,42 (1H, s), 3,09 (1H, dd), 3,02 (1H, d), 2,96 (1H, d), 2,32 (3H, s), 2,29 - 2,24 (1H, m), 2,27 (3H, s), 2,08 (6H, s), 1,91 - 1,85 (1H, m).
T72		δ _H 7,25 - 7,18 (4H, m), 6,86 (1H, s), 6,84 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,68 (1H, d), 3,61 - 3,56 (1H, m), 2,90 (1H, d), 2,80 (1H, d), 2,35 (3H, s), 2,32 - 2,28 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,92 (1H, dd).
T73		δ _H 7,29 - 7,27 (3H, m), 7,22 - 7,19 (2H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,85 (1H, d), 4,61 (1H, s), 3,01 (1H, dd), 2,26 (3H, s), 2,19 (1H, dd), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,00 - 1,96 (1H, m).
T74		δ _H 6,90 (1H, s), 6,88 (1H, s), 6,86 - 6,82 (2H, m), 4,82 - 4,77 (2H, m), 3,12 - 3,05 (2H, m), 2,28 - 2,86 (1H, m), 2,41 - 2,39 (1H, m), 2,26 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,11 (6H, s), 2,08 (3H, s), 2,01 - 1,97 (1H, m).

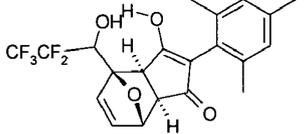
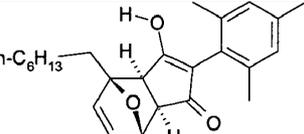
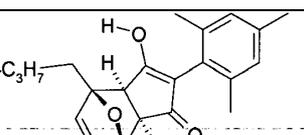
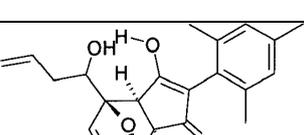
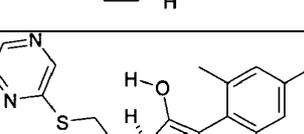
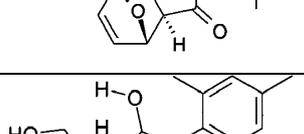
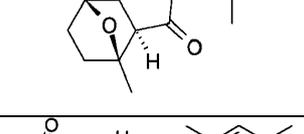
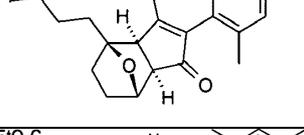
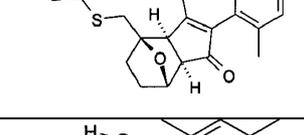
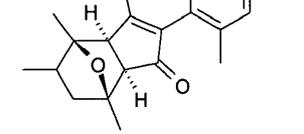
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T75		δ _H 7,79 - 7,76 (1H, m), 7,59 - 7,56 (1H, m), 7,28 - 7,20 (2H, m), 6,90 (1H, s), 6,89 (1H, s), 4,88 - 4,86 (1H, m), 4,67 (1H, s), 3,47 - 3,42 (1H, m), 3,14 - 3,00 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,25 - 2,21 (1H, m), 2,11 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,88 - 1,84 (1H, m).
T76		δ _H 7,39 - 7,35 (1H, m), 7,19 - 7,16 (1H, m), 6,93 - 6,83 (4H, m), 4,82 (1H, brs), 4,62 (1H, s), 3,48 (3H, s), 3,54 (1H, dd), 3,13 - 3,02 (2H, brm), 2,26 (3H, s), 2,17 - 2,13 (1H, m), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,90 - 1,84 (1H, m).
T77		δ _H 7,42 (1H, d), 7,21 - 7,12 (3H, m), 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,82 (1H, s), 4,82 (1H, d), 4,68 (1H, s), 3,51 (1H, dd), 2,47 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,23 - 2,20 (1H, m), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,85 - 1,81 (1H, m).
T78		δ _H 7,73 - 7,70 (2H, m), 7,59 (1H, d), 7,52 - 7,50 (1H, m), 7,31 - 7,28 (1H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,86 (1H, br S), 4,64 (1H, s), 3,42 (1H, br S), 3,13 - 3,05 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,66 - 2,24 (1H, m), 2,11 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,92 - 1,88 (1H, m).
T79		δ _H 7,42 - 7,39 (1H, m), 7,18 - 7,11 (3H, m), 6,91 (1H, s), 6,90 (1H, s), 4,87 - 4,85 (1H, m), 4,74 (1H, s), 3,24 - 3,22 (1H, m), 3,13 - 3,07 (2H, m), 2,36 (3H, s), 2,34 (3H, s), 2,24 - 2,22 (1H, m), 2,19 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,88 - 1,86 (1H, m).
T80		δ _H 7,79 - 7,73 (2H, m), 7,56 (1H, t), 7,35 (1H, t), 6,90 (1H, s), 6,89 (1H, s), 4,87 (1H, br s), 4,71 (1H, s), 3,47 (1H, br. s), 3,13 - 3,06 (2H, m), 2,42 - 2,30 (1H, m), 2,26 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,98 - 1,97 (1H, m).
T81		δ _H 7,45 - 7,43 (1H, m), 7,18 - 7,16 (1H, m), 7,11 - 7,08 (1H, m), 7,02 - 6,98 (1H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,85 (1H, d), 4,65 (1H, s), 3,44 (1H, br. s), 3,15 - 3,00 (2H, br. s), 2,26 (3H, s), 2,22 - 2,17 (1H, m), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,92 - 1,88 (1H, s).
T82		δ _H 7,47 - 7,96 (2H, m), 7,14 - 7,11 (2H, m), 6,90 (2H, s), 4,88 (1H, s), 4,57 (1H, s), 3,21 (1H, s), 2,94 - 2,74 (2H, br. s), 2,62, (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,25 - 2,23 (1H, m), 2,11 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,01 - 1,93 (1H, m).
T83		-δ _H 7,75 - 7,66 (1H, m), 7,25 - 7,21 (1H, m), 7,06 - 7,02 (2H, m), 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,83 (1H, br. s), 4,59 (1H, s), 3,00 - 2,98 (1H, m), 2,83 - 2,70 (2H, br. s), 2,25 (3H, s), 2,20 - 2,16 (1H, m), 2,09 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,92 - 1,89 (1H, m).
T84		δ _H 7,79 - 7,77 (1H, m), 7,21 - 7,18 (1H, m), 6,89 - 6,86 (3H, m), 6,76 - 6,74 (1H, m), 4,83 (1H, d), 4,62 (1H, s), 3,80 (3H, s), 2,99 (1H, dd), 2,80 - 2,70 (2H, br. s), 2,26 (3H, s), 2,18 (1H, dd), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,97 - 1,95 (1H, m).

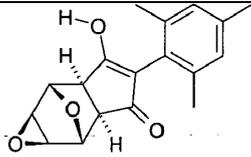
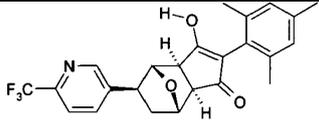
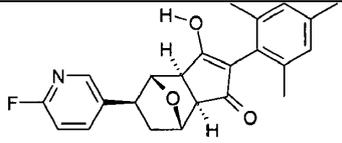
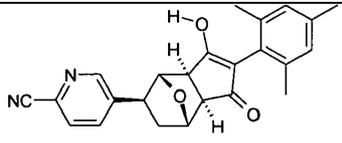
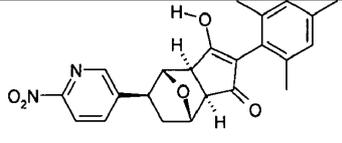
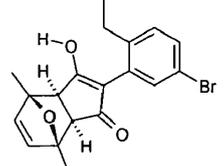
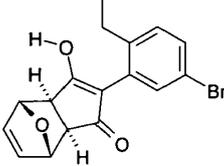
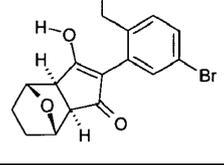
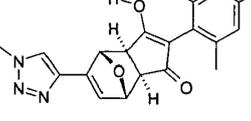
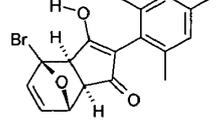
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T85		δ _H 7,54 - 7,46 (3H, m), 7,41 - 7,38 (1H, m), 6,87 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,85 (1H, d), 4,60 (1H, s), 3,06 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,21 (1H, dd), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,93 - 1,90 (1H, m).
T86		δ _H 7,19 - 7,08 (3H, m), 7,03 - 7,07 (1H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,84 (1H, d), 4,60 (1H, s), 2,98 (1H, dd), 2,33 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,17 (1H, dd), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,97 - 1,95 (1H, br. m).
T87		δ _H 8,09 - 8,07 (1H, m), 7,68 - 7,67 (2H, m), 7,46 (1H, t), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,89 (1H, d), 4,62 (1H, s), 3,13 (1H, dd), 2,28 - 2,24 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,95 - 1,95 (1H, m).
T88		δ _H 7,88 - 7,86 (1H, m), 7,79 (1H, d), 7,55 - 7,53 (1H, m), 7,39 (1H, t), 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,87 (1H, d), 4,61 (1H, s), 3,09 (1H, dd), 2,60 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,23 - 2,20 (1H, m), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,96 - 1,94 (1H, m).
T89		δ _H 7,62 - 7,60 (1H, m), 7,56 - 7,50 (2H, m), 7,39 (1H, t), 6,90 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,88 (1H, br. s), 4,59 (1H, s), 3,05 - 3,03 (1H, m), 2,26(3H, s), 2,24 - 2,20 (1H, m), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,92 - 1,89 (1H, m).
T90		δ _H 8,14 (2H, d), 7,47 (2H, d), 6,89 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,89 (1H, d), 4,63 (1H, s), 3,12 (1H, dd), 2,27 - 2,23 (1H, m), 2,26 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,95 - 1,91 (1H, m).
T91		δ _H 7,35 - 7,31 (2H, m), 7,15 - 7,12 (2H, m), 6,91 (1H, s), 6,90 (1H, s), 4,87 (1H, br. s), 4,61 (1H, s), 3,07 - 3,05 (1H, m), 2,27 (3H, s), 2,22 - 2,20 (1H, m), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,93- 1,91 (1H, m).
T92		δ _H 7,54 (2H, d), 7,43 - 7,41 (2H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,87 (1H, d), 4,61 (1H, s), 3,07 (1H, dd), 2,26 (3H, s), 2,23 (1H, dd), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,95 - 1,91 (1H, m).
T93		δ _H 7,57 (2H, d), 7,41 (2H, d), 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,86 (1H, d), 4,60 (1H, s), 3,05 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,23 - 2,20 (1H, m), 2,09 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,95 - 1,91 (1H, m).
T94		δ _H 7,31 - 7,29 (2H, m), 7,24 - 7,22 (2H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,85 (1H, d), 4,59 (1H, s), 3,00 (1H, dd), 2,26 (3H, s), 2,17 (1H, dd), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,99 - 1,96 (1H, m), 1,30 (9H, s).
T95		δ _H 7,88 (2H, d), 7,41 - 7,38 (2H, m), 6,90 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,88 (1H, br. s), 4,63 (1H, s), 3,08 (1H, br. s), 2,58 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,23 - 2,21 (1H, m), 2,11 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,95 - 1,93 (1H, m).

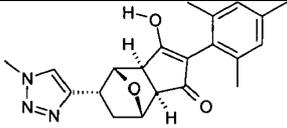
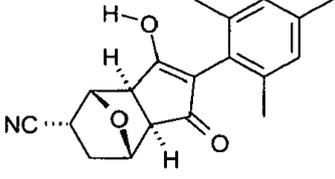
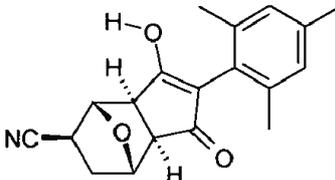
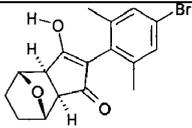
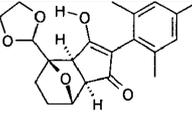
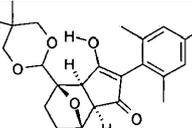
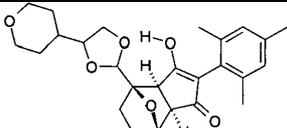
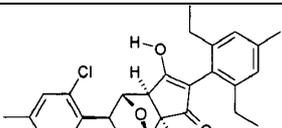
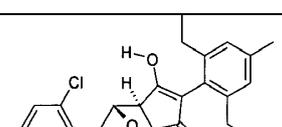
ES 2 497 501 T3

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T96		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 428; rt = 1,52 min.
T97		δ _H 6,85 (2H, s), 4,50 (1H, d), 4,37 (1H, d), 3,31 - 3,29 (1H, m), 3,12 (1H, d), 2,81 (1H, d), 2,24 (3H, s), 2,14 - 2,07 (1H, m), 2,05 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,12 (3H, d), 1,07 (1H, dd).
T98		δ _H 7,33 - 7,18 (5H, m), 6,84 - 6,81 (2H, m), 6,35 (1H, d), 6,08 (1H, dd), 4,63 (1H, d), 4,42 (1H, s), 2,68 - 2,63 (2H, m), 2,55 - 2,48 (1H, m), 2,22 (3H, s), 2,04 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,85 - 1,80 (1H, m), 1,64 - 1,60 (1H, m).
T99		δ _H 6,90 - 6,89 (2H, m), 5,80 - 5,71 (1H, m), 5,05 - 4,97 (2H, m), 4,68 (1H, d), 4,44 (1H, s), 2,81 - 2,76 (2H, m), 2,51 - 2,46 (1H, m), 2,26 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,89 - 1,84 (1H, m), 1,67 - 1,62 (1H, m).
T100		δ _H 7,27 - 7,12 (5H, m), 6,83 (2H, br. s), 4,55 (1H, d), 4,33 (1H, s), 2,75 - 2,71 (2H, m), 2,64 (2H, t), 2,23 (3H, s), 2,04 (6H, s), 1,74 - 1,68 (3H, m), 1,57 - 1,50 (1H, m), 1,44 - 1,41 (1H, m).
T101		δ _H 6,87 (2H, s), 6,40 (1H, d), 4,95 (1H, s), 4,82 (1H, s), 2,90 (1H, d), 2,81 (1H, d), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,03 (3H, s).
T102		δ _H 6,82 (2H, s), 4,47 (1H, d), 4,25 (1H, s), 2,50 - 2,46 (2H, m), 2,22 (3H, s), 2,02 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,69 - 1,50 (4H, m), 1,34 - 1,12 (6H, m), 0,88 - 0,86 (6H, m).
T103		δ _H 6,81 (2H, s), 4,47 (1H, d), 4,24 (1H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 - 2,47 (2H, m), 2,28 - 2,20 (5H, m), 2,00 (6H, s), 1,70 - 1,48 (4H, m), 1,27 - 1,24 (1H, m).
T104		Mezcla aproximadamente 85:15 de isómeros E y Z. Isómero E: δ _H 6,84 (2H, s), 5,42 - 5,26 (2H, m), 4,53 (1H, d), 4,29 (1H, s), 2,58 (1H, m), 2,37 - 2,29 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,02 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,86 - 1,83 (2H, m), 1,75 - 1,70 (1H, m), 1,63 - 1,47 (3H, m), 0,89 - 0,86 (6H, m).
T105		Mezcla aproximadamente 3:2 de isómeros E y Z. Isómero E: δ _H 6,80 (2H, s), 6,74 (1H, dd), 5,91 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,30 (1H, s), 3,33 (3H, s), 2,85 - 2,77 (3H, m), 2,21 (3H, s), 1,97 (3H, s), 1,94 (3H, s), 1,94 - 1,91 (1H, m), 1,59 - 1,54 (1H, m).
T106		δ _H 6,82 (2H, s), 4,44 (1H, d), 4,24 (1H, s), 2,45 - 2,40 (2H, m), 2,22 (3H, s), 2,02 (6H, s), 1,58 - 1,52 (2H, m), 1,38 - 1,33 (1H, m), 1,25 - 1,16 (2H, m), 0,85 - 0,82 (3H, m).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T107		δ_H 6,85 (2H, s), 4,51 (1H, d), 4,43 (1H, d), 3,07 (1H, d), 2,82 - 2,81 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,10 - 2,05 (2H, m), 2,04 (6H, s), 1,87 - 1,79 (1H, m), 1,53 - 1,46 (2H, m), 1,00 (3H, t).
T108		δ_H 8,82 (1H, s), 8,76 (1H, d), 8,03 (1H, dd), 6,82 (2H, s), 4,90 (1H, d), 4,63 (1H, s), 3,55 (1H, dd), 3,16 (1H, d), 3,08 (1H, d), 2,46 - 2,40 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,08 (6H, s), 2,02 - 1,96 (1H, m).
T109		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 327; rt = 4,97 min.
T110		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 369; rt = 4,98 min.
T111		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 412; rt = 5,70 min.
T112		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 435; rt = 4,23 min.
T113		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 353; rt = 4,48 min.
T114		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 371; rt = 5,23 min.
T115		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 325; rt = 4,22 min.
T116		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 371; rt = 5,51 min.

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T117		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 431; rt = 4,98 min.
T118		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 381; rt = 7,34 min.
T119		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 339; rt = 6,54 min.
T120		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 353; rt = 5,23 min.
T121		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 407; rt = 5,04 min.
T122		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 329; rt = 1,18 min.
T123		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 355; rt = 1,32 min.
T124		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 43; rt = 1,58 min.
T125		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 327; rt = 1,45 min.
T126		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 383; rt = 1,93 min.

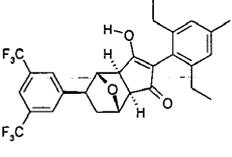
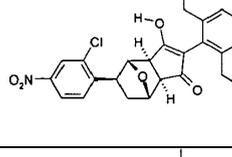
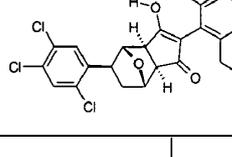
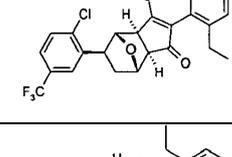
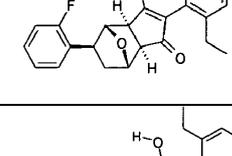
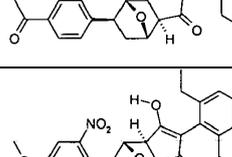
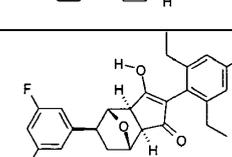
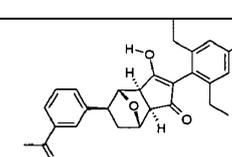
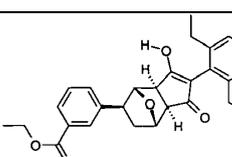
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T127		d ₄ -MeOH δ _H 6,84 (2H, s), 4,50 (2H, s), 3,56 (2H, s), 2,88 (2H, s), 2,23 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,02 (3H, s).
T128		d ₄ -MeOH δ _H 8,68 (1H, d), 8,03 (1H, dd), 7,78 (1H, d), 6,89 (2H, s), 4,83 (1H, d), 4,52 (1H, s), 3,36 - 3,34 (1H, m), 3,10 (1H, d), 3,03 (1H, d), 2,83 (1H, dd), 2,27 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,93 - 1,88 (1H, m).
T129		d ₄ -MeOH δ _H 8,10 (1H, d), 7,95 - 7,90 (1H, m), 7,00 (1H, dd), 6,85 (2H, s), 4,77 (1H, d), 4,41 (1H, s), 3,21 (1H, dd), 3,03 (1H, d), 2,96 (1H, d), 2,30 (1H, dd), 2,23 (3H, s), 2,05 (6H, s), 1,85 - 1,80 (1H, m).
T130		d ₄ -MeOH δ _H 8,65 (1H, d), 7,97 (1H, dd), 7,81 (1H, d), 6,85 (2H, s), 4,80 (1H, d), 4,48 (1H, s), 3,34 - 3,31 (1H, m), 3,06 (1H, d), 2,99 (1H, d), 2,35 (1H, dd), 2,24 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,91 - 1,86 (1H, m).
T131		d ₄ -MeOH δ _H 8,63 (1H, d), 8,34 (1H, d), 8,22 (1H, dd), 6,92 (2H, s), 4,88 (1H, d), 4,56 (1H, s), 3,48 (1H, dd), 3,14 (1H, d), 3,06 (1H, d), 2,43 (1H, dd), 2,31 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,00 - 1,94 (1H, m).
T132		d ₄ -MeOH δ _H 7,39 (1H, dd), 7,18 (1H, d), 7,16 (1H, d), 6,35 (2H, s), 2,79 (2H, s), 2,46 (2H, q), 1,61 (6H, s), 1,07 (3H, t)
T133		d ₄ -MeOH δ _H 7,37 (1H, dd), 7,17 (1H, d), 7,14 (1H, d), 6,54 (2H, s), 4,96 (2H, s), 2,79 (2H, s), 2,44 (2H, q), 1,06 (3H, t)
T134		d ₄ -MeOH δ _H 7,34 (1H, dd), 7,15 (2H, d), 4,59 (2H, s), 2,78 (2H, s), 2,43 (2H, q), 1,81 - 1,78 (2H, m), 1,66 - 1,61 (2H, m), 1,06 (3H, t)
T135		d ₄ -MeOH δ _H 8,13 (1H, s), 6,80 (2H, s), 6,76 (1H, d), 5,28 (1H, s), 5,06 (1H, d), 4,11 (3H, s), 2,71 (1H, d), 2,60 (1H, d), 2,21 (3H, s), 2,08 (6H, s).
T136		δ _H 6,82 (2H, s), 6,48 - 6,44 (2H, m), 4,98 (1H, s), 2,93 - 2,87 (2H, m), 2,19 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,02 (3H, s).

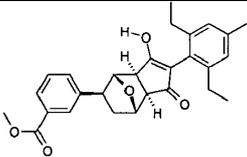
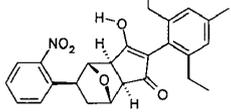
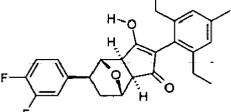
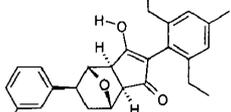
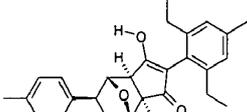
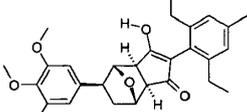
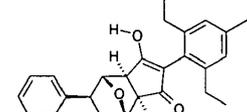
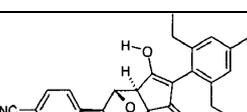
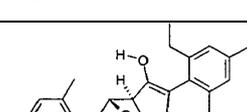
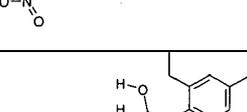
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T137		d ₄ -MeOH δ _H 7,93 (1H, s), 6,82 (1H, s), 6,80 (1H, s), 4,72 (1H, d), 4,71 (1H, d), 4,12 (3H, s), 3,59 - 3,54 (1H, m), 2,76 (1H, d), 2,66 (1H, d), 2,41 - 2,32 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,06 (3H, s), 2,00 - 1,95 (1H, m).
T138	 Isómero A  Isómero B	Mezcla aproximadamente 9:1 de Isómero A: Isómero B. Isómero A: d ₄ -MeOH δ _H 6,83 (2H, s), 4,77 (1H, d), 4,69 (1H, d), 3,22 (1H, d), 3,16 - 3,13 (1H, m), 2,85 (1H, d), 2,35 - 2,29 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,87 (1H, dd).
T139		d ₆ -DMSO δ _H 7,17 (1H, s), 7,18 (1H, s), 6,50 (2H, s), 4,86 (2H, s), 2,7 (2H, br. s), 2,00 (3H, s), 1,95 (3H, s)
T140		d ₄ -MeOH δ _H 6,83 (2H, s), 5,35 (1H, s), 4,64 (1H, d), 4,05 - 3,93 (4H, m), 2,84 - 2,80 (2H, m), 2,24 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,93 - 1,85 (2H, m), 1,73 - 1,68 (1H, m), 1,58 - 1,54 (1H, m).
T141		d ₄ -MeOH δ _H 6,82 (1H, s), 6,80 (1H, s), 5,04 (1H, s), 4,62 (1H, d), 3,66 - 3,49 (4H, m), 2,72 - 2,67 (2H, m), 2,23 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,11 - 2,08 (1H, m), 1,94 - 1,83 (1H, m), 1,70 - 1,62 (2H, m), 1,21 (3H, s), 0,74 (3H, s).
T142		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 439; rt = 1,35 min.
T143		δ _H 7,32 (1H, d), 7,15 (1H, s), 7,02 (1H, d), 6,91 - 6,90 (2H, m), 4,75 - 4,73 (1H, br. m), 4,62 (1H, s), 3,46 - 3,44 (1H, m), 2,95 - 2,84 (2H, m), 2,37 - 2,28 (10H, m), 2,16 - 2,11 (1H, m), 1,76 - 1,73 (1H, m), 1,06 - 1,02 (6H, m).
T144		δ _H 7,48 (1H, s), 7,28 (1H, s), 7,13 (1H, d), 6,96 - 6,94 (2H, m), 4,86 (1H, s), 4,68 (1H, s), 3,52 (1H, s with fine splitting), 3,11 - 2,90 (2H, m), 2,40 - 2,23 (8H, m), 1,83 - 1,80 (1H, m), 1,10 - 1,06 (6H, m).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T145		δ _H 7,26 - 7,21 (2H, m), 7,05 - 7,02 (2H, m), 6,94 - 6,88 (3H, m), 4,81 (1H, s), 4,59 (1H, s), 2,99 - 2,85 (3H, m), 2,40 - 2,30 (7H, m), 2,19 - 2,14 (1H, m), 1,91 - 1,89 (1H, m), 1,06 (6H, t).
T146		δ _H 7,08 - 7,05 (1H, m), 6,97 - 6,92 (4H, m), 4,80 (1H, br. s), 4,56 (1H, s), 3,10 - 2,82 (3H, m), 2,38 - 2,33 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,18 - 2,11 (1H, m), 1,90 - 1,86 (1H, m), 1,08 - 1,05 (6H, m).
T147		δ _H 7,16 - 7,13 (1H, m), 7,08 - 7,05 (1H, m), 6,96 (1H, s), 6,94 (1H, s), 6,81 - 6,78 (1H, m), 4,86 (1H, br. s), 4,67 (1H, s), 3,18 (1H, br. s), 3,10 (1H, br. s), 2,85 (1H, br. s), 2,40 - 2,36 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,23 - 2,18 (1H, m), 1,81 (1H, br. s), 1,10 - 1,06 (6H, m).
T148		δ _H 7,34 - 7,31 (1H, m), 7,25 - 7,15 (3H, m), 6,96 (1H, s), 6,94 (1H, s), 4,87 - 4,85 (1H, m), 4,65 (1H, s), 3,11 - 3,08 (1H, m), 3,02 - 2,98 (1H, m), 2,86 - 2,80 (1H, m), 2,43 - 2,33 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,23 - 2,18 (1H, m), 2,00 - 1,92 (1H, m), 1,09 - 1,06 (6H, m).
T149		δ _H 7,36 (1H, d), 7,16 - 7,13 (1H, m), 7,04 (1H, t), 6,95 (1H, s), 6,94 (1H, s), 4,83 (1H, br. s), 4,56 (1H, s), 2,96 - 2,83 (3H, m), 2,39 - 2,35 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,21 - 2,16 (1H, m), 1,88 - 1,85 (1H, m), 1,08 - 1,05 (6H, m).
T150		δ _H 7,41 - 7,39 (1H, m), 7,35 - 7,33 (1H, m), 7,12 - 7,10 (1H, m), 6,94 (1H, s), 6,93 (1H, s), 4,82 - 4,80 (1H, m), 4,56 (1H, s), 2,98 - 2,80 (3H, m), 2,37 - 2,33 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,19 - 2,15 (1H, m), 1,87 - 1,83 (1H, m), 1,08 - 1,04 (6H, m).
T151		δ _H 7,28 (1H, br. s), 7,13 - 7,11 (1H, m), 7,07 - 7,05 (1H, m), 6,94 (1H, s), 6,92 (1H, s), 4,79 - 4,78 (1H, m), 4,55 (1H, s), 2,95 - 2,80 (3H, m), 2,39 - 2,34 (4H, m), 2,33 (3H, s), 2,30 (3H, s), 2,15 - 2,10 (1H, m), 1,89 - 1,84 (1H, m), 1,07 - 1,04 (6H, m).
T152		δ _H 7,22 - 7,18 (3H, m), 6,93 (1H, s), 6,92 (1H, s), 4,79 (1H, s), 4,56 (1H, s), 2,93 - 2,88 (2H, m), 2,37 - 2,32 (5H, m), 2,29 (3H, s), 2,13 (1H, br. m), 1,85 (1H, br. m), 1,07 - 1,04 (6H, m).
T153		δ _H 7,21 - 7,18 (1H, m), 6,94 (1H, s), 6,93 (1H, s), 6,90 - 6,84 (2H, m), 6,76 - 6,74 (1H, m), 4,81 (1H, br. s), 4,60 (1H, s), 3,80 (3H, s), 2,97 - 2,83 (2H, m), 2,83 - 2,35 (5H, m), 2,30 (3H, s), 2,16 - 2,14 (1H, m), 2,00 - 1,96 (1H, m), 1,09 - 1,04 (6H, m).
T154		δ _H 7,53 - 7,39 (4H, m), 6,94 - 6,93 (2H, m), 4,82 (1H, br. s), 4,59 (1H, d), 3,04 - 3,02 (1H, m), 2,93 - 2,89 (2H, br. m), 2,38 - 2,33 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,92 - 1,90 (1H, m), 1,08 - 1,04 (6H, m).

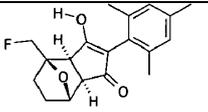
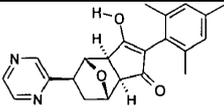
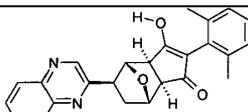
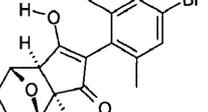
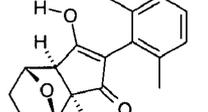
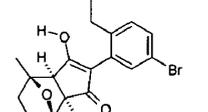
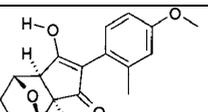
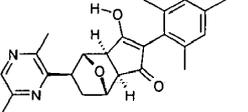
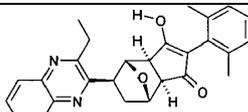
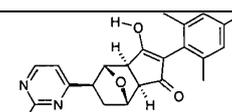
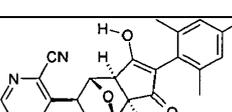
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T155		δ _H 7,26 - 7,25 (4H, m), 6,95 - 6,94 (2H, m), 4,84 (1H, s), 4,60 - 4,57 (1H, m), 3,09 - 3,06 (1H, m), 2,99 - 2,97 (1H, m), 2,85 - 2,80 (1H, m), 2,40 - 2,36 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,22 - 2,17 (1H, m), 1,93 - 1,89 (1H, m), 1,09 - 1,05 (6H, m).
T156		δ _H 7,22 - 7,20 (2H, m), 6,95 - 6,93 (2H, m), 6,84 - 6,82 (2H, m), 4,83 - 4,82 (1H, br. m), 4,56 (1H, s), 3,78 (3H, s), 2,98 - 2,95 (1H, m), 2,90 - 2,75 (2H, br. s), 2,39 - 2,35 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,19 - 2,13 (1H, m), 1,95 - 1,89 (1H, m), 1,09 - 1,05 (6H, m).
T157		δ _H 7,57 - 7,53 (1H, m), 7,44 - 7,42 (1H, m), 7,09 - 7,05 (1H, m), 6,93 (2H, s), 4,84 (1H, br. s), 4,70 (1H, br. s), 3,45 - 3,33 (1H, m), 3,10 - 2,90 (2H, m), 2,37 - 2,32 (4H, m), 2,29 (3H, s), 1,85 - 1,83 (2H, m), 1,09 - 1,04 (6H, m).
T158		δ _H 8,15 (2H, d), 7,46 (2H, dd), 6,95 (1H, s), 6,94 (1H, s), 4,88 (1H, s con division fina), 4,62 (1H, s), 4,62 (1H, s), 3,12 - 3,10 (1H, m), 2,99 - 2,90 (2H, br. m), 2,40 - 2,35 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,25 - 2,22 (1H, m), 1,93 - 1,89 (1H, m), 1,08 - 1,05 (6H, m).
T159		δ _H 7,31 - 7,28 (2H, m), 7,13 - 7,12 (2H, m), 6,94 - 6,93 (2H, m), 4,84 - 4,81 (1H, m), 4,57 (1H, d), 3,00 - 2,99 (4H, m), 2,98 - 2,85 (2H, br. m), 2,38 - 2,33 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,17 - 2,14 (1H, m), 1,90 - 1,87 (1H, m), 1,08 - 1,04 (6H, m).
T160		δ _H 7,58 (2H, dd), 7,41 - 7,40 (2H, m), 6,95 (1H, s), 4,87 - 4,85 (1H, m), 4,60 (1H, d), 3,06 - 3,03 (1H, m), 3,04 - 2,95 (2H, br. m), 2,40 - 2,33 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,25 - 2,20 (1H, m), 1,93 - 1,88 (1H, m), 1,09 - 1,05 (6H, m).
T161		δ _H 8,18 (1H, s), 8,10 - 8,08 (1H, m), 7,69 - 7,67 (1H, m), 7,48 (1H, t), 6,97 (1H, s), 6,95 (1H, s), 4,91 (1H, d), 4,64 (1H, s), 3,18 - 3,13 (1H, m), 3,10 - 2,95 (2H, br. m), 2,40 - 2,36 (4H, m), 2,31 (3H, s), 1,08 (6H, t).
T162		δ _H 7,25 - 7,15 (4H, m), 6,96 (1H, s), 6,94 (1H, s), 4,85 (1H, s), 4,58 (1H, br. s), 3,10 - 3,05 (1H, br. m), 3,00 - 2,97 (1H, m), 2,87 - 2,85 (1H, m), 2,47 (3H, s), 2,42 - 2,34 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,21 - 2,17 (1H, m), 1,96 - 1,91 (1H, m), 1,00 - 1,05 (6H, m).
T163		δ _H 7,42 - 7,38 (1H, m), 6,94 - 6,92 (2H, m), 6,85 - 6,83 (1H, m), 6,77 - 6,73 (1H, m), 4,82 - 4,80 (1H, m), 4,59 (1H, d), 3,38 - 3,34 (1H, m), 3,05 - 2,91 (2H, br. m), 2,37 - 2,34 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,19 - 2,15 (1H, m), 1,85 - 1,80 (1H, m), 1,08 - 1,04 (6H, m).
T164		δ _H 7,22 - 7,20 (1H, m), 7,05 - 7,00 (2H, m), 6,94 (1H, s), 6,92 (1H, s), 4,83 (1H, s), 4,79 (1H, br. s), 3,85 - 3,82 (1H, m), 3,06 - 2,89 (2H, br. m), 2,51 (3H, s), 2,39 - 2,33 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,18 - 2,14 (1H, m), 1,99 - 1,95 (1H, m), 1,05 (6H, t).
T165		δ _H 7,35 (1H, t), 7,16 - 7,12 (1H, m), 6,96 (1H, s), 6,61 - 6,53 (1H, m), 4,86 (1H, br. s), 4,66 (1H, s), 3,17 - 3,09 (2H, m), 2,87 - 2,85 (1H, m), 2,42 - 2,35 (4H, m), 2,32 (6H, s), 2,26 - 2,18 (1H, m), 1,83 - 1,76 (1H, m), 1,08 (6H, t).

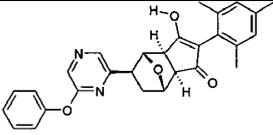
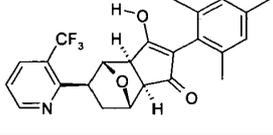
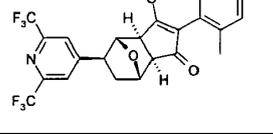
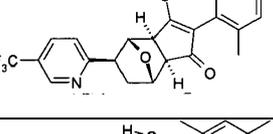
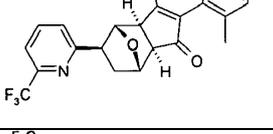
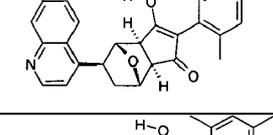
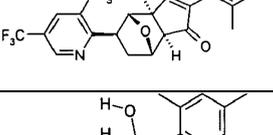
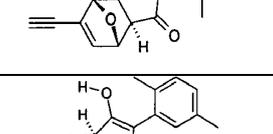
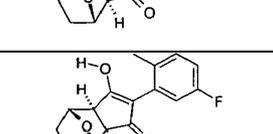
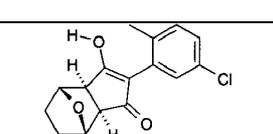
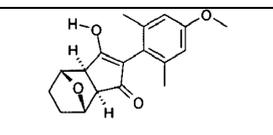
ES 2 497 501 T3

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T166		δ _H 7,76 - 7,74 (3H, m), 6,96 (1H, s), 6,94 (1H, s), 4,89 (1H, br. s), 4,62 (1H, s), 3,15 - 3,13 (1H, m), 3,12 - 3,07 (1H, br. m), 2,87 (1H, br. s), 2,43 - 2,36 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,28 - 2,25 (1H, m), 1,92 - 1,90 (1H, m), 1,09 - 1,06 (6H, m).
T167		δ _H 8,26 - 8,24 (1H, m), 8,10 (1H, dd), 7,71 (1H, d), 6,96 (1H, s), 9,95 (1H, s), 4,89 (1H, br. s), 4,73 (1H, br. s), 3,62 (1H, br. s), 3,13 (1H, br. s), 2,94 (1H, br. s), 2,39 - 2,33 (4H, m), 2,31 (3H, s), 1,82 - 1,80 (1H, m), 1,67 - 1,65 (1H, m), 1,08 (6H, t).
T168		δ _H 7,58 (1H, s), 7,46 (1H, d), 6,97 (1H, s), 6,95 (1H, s), 4,88 (1H, br. s), 4,64 (1H, s), 3,49 - 3,47 (1H, m), 3,17 - 2,86 (2H, br. m), 2,40 - 2,35 (4H, m), 2,32 (3H, s), 1,81 - 1,79 (1H, m), 1,58 - 1,56 (1H, m), 1,10 - 1,06 (6H, m).
T169		δ _H 7,73 (1H, s), 7,48 - 7,41 (2H, m), 6,96 (1H, s), 6,93 (1H, s), 4,84 (1H, br. s), 4,69 (1H, s), 3,58 (1H, br. s), 3,08 - 2,93 (2H, br. m), 2,38 - 2,32 (4H, m), 2,31 (3H, s), 2,27 - 2,35 (1H, m), 1,84 - 1,80 (1H, m), 1,10 - 1,05 (6H, m).
T170		δ _H 7,43 - 7,38 (1H, m), 7,19 - 7,14 (1H, m), 7,11 - 7,07 (1H, m), 7,01 - 6,96 (1H, m), 6,90 - 6,89 (2H, m), 4,75 (1H, d), 4,60 (1H, s), 3,35 (1H, dd), 2,90 - 2,83 (2H, m), 2,37 - 2,29 (4H, m), 2,28 (3H, s), 2,12 - 2,07 (1H, m), 1,84 - 1,78 (1H, m), 1,06 - 1,01 (6H, m).
T171		δ _H 7,86 (2H, d), 7,34 (2H, d), 6,91 - 6,90 (2H, m), 4,76 (1H, d), 4,57 (1H, s), 2,97 (1H, dd), 2,87 - 2,83 (2H, m), 2,58 (3H, s), 2,42 - 2,32 (4H, m), 2,28 (3H, s), 2,10 - 2,02 (1H, m), 1,87 - 1,82 (1H, m), 1,09 - 1,05 (6H, m).
T172		δ _H 7,61 (1H, d), 7,30 (1H, d), 7,12 (1H, dd), 6,94 - 6,93 (2H, m), 4,81 (1H, d), 4,67 (1H, s), 3,85 (3H, s), 3,40 (1H, dd), 3,04 - 2,88 (2H, br. s), 2,40 - 2,31 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,29 - 2,26 (1H, m), 1,89 - 1,86 (1H, m), 1,06 (6H, t).
T173		δ _H 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 6,78 - 6,73 (2H, m), 6,67 - 6,61 (1H, m), 4,66 (1H, d), 4,48 (1H, s), 2,81 (1H, dd), 2,74 (2H, br. s), 2,33 - 2,27 (4H, m), 2,26 (3H, s), 2,05 - 1,98 (1H, m), 1,77 - 1,71 (1H, m), 1,02 (6H, t).
T174		δ _H 7,78 - 7,73 (2H, m), 7,44 - 7,42 (1H, m), 7,35 (1H, t), 6,84 (2H, s), 4,69 (1H, d), 4,50 (1H, s), 2,93 (1H, dd), 2,79 - 2,76 (2H, m), 2,54 (3H, s), 2,35 - 2,26 (4H, m), 2,22 (3H, s), 2,05 - 2,00 (1H, m), 1,82 - 1,76 (1H, m), 1,04 - 0,99 (6H, m).
T175		δ _H 7,95 (2H, d), 7,28 (2H, d), 6,91 - 6,90 (2H, m), 4,69 (1H, d), 4,53 (1H, s), 4,38 (2H, q), 2,91 (1H, dd), 2,79 - 2,76 (2H, m), 2,40 - 2,31 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,03 - 1,97 (1H, m), 1,83 - 1,77 (1H, m), 1,43 (2H, t), 1,06 (6H, t).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T176		δ _H 7,94 (2H, d), 7,33 (2H, d), 6,92 - 6,91 (2H, m), 4,81 (1H, d), 4,60 (1H, s), 3,89 (3H, s), 3,02 (1H, dd), 2,97 - 2,80 (2H, br. m), 2,38 - 2,30 (4H, m), 2,29 (3H, s), 2,16 (1H, dd), 1,93 - 1,87 (1H, m), 1,07 - 1,03 (6H, m).
T177		δ _H 7,78 (1H, dd), 7,71 (1H, dd), 7,59 - 7,54 (1H, m), 7,37 - 7,33 (1H, m), 6,91 - 6,90 (2H, m), 4,79 (1H, d), 4,69 (1H, s), 3,42 (1H, dd), 2,93 (1H, br. s), 2,88 - 2,86 (1H, m), 2,39 - 2,30 (4H, m), 2,28 (3H, s), 2,28 - 2,26 (1H, m), 1,91 - 1,85 (1H, m), 1,05 (6H, t).
T178		δ _H 7,05 - 6,97 (2H, m), 6,87 - 6,83 (3H, m), 4,62 (1H, d), 4,41 (1H, s), 2,76 (1H, dd), 2,70 (2H, br. s), 2,34 - 2,24 (5H, m), 2,26 (3H, s), 1,97 - 1,92 (1H, m), 1,71 - 1,66 (1H, m), 1,00 (6H, t).
T179		δ _H 7,15 (1H, t), 7,07 (1H, s), 7,02 - 7,00 (2H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,70 (1H, d), 4,51 (1H, s), 2,85 (1H, dd), 2,80 - 2,76 (2H, m), 2,37 - 2,31 (4H, m), 2,32 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,04 - 1,98 (1H, m), 1,87 - 1,82 (1H, m), 1,05 - 1,01 (6H, m).
T180		δ _H 7,11 - 7,05 (4H, m), 6,88 - 6,87 (2H, m), 4,67 (1H, d), 4,47 (1H, s), 2,84 (1H, dd), 2,77 - 2,73 (2H, m), 2,36 - 2,28 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,01 - 1,96 (1H, m), 1,84 - 1,79 (1H, m), 1,05 - 1,00 (6H, m).
T181		δ _H 6,90 (1H, s), 6,89 (1H, s), 6,47 (2H, s), 4,70 (1H, d), 4,51 (1H, s), 3,84 (6H, s), 3,80 (3H, s), 2,84 - 2,79 (3H, m), 2,37 - 2,30 (4H, m), 2,28 (3H, s), 2,07 - 2,02 (1H, m), 1,86 - 1,80 (1H, m), 1,07 - 1,02 (6H, m).
T182		δ _H 7,53 (1H, s), 7,49 - 7,43 (2H, m), 7,38 - 7,34 (1H, m), 6,89 (1H, s), 6,88 (1H, s), 4,71 (1H, d), 4,47 (1H, s), 2,89 (1H, dd), 2,82 - 2,78 (2H, m), 2,36 - 2,26 (4H, m), 2,25 (3H, s), 2,05 (1H, dd), 1,78 - 1,72 (1H, m), 1,02 (6H, t).
T183		δ _H 7,79 (1H, d), 7,74 - 7,72 (1H, m), 7,69 - 7,66 (1H, m), 6,96 (1H, s), 6,95 (1H, s), 4,90 (1H, d), 4,60 (1H, s), 3,11 (1H, dd), 2,99 (2H, br. s), 2,40 - 2,32 (4H, m), 2,30 (3H, s), 2,29 - 2,26 (1H, m), 1,90 - 1,84 (1H, m), 1,09 - 1,05 (6H, m).
T184		δ _H 8,29 (1H, d), 7,97 (1H, dd), 7,29 (1H, d), 6,97 (1H, s), 6,95 (1H, s), 4,92 (1H, d), 4,72 (1H, s), 3,26 (1H, dd), 3,03 (2H, br. s), 2,43 (3H, s), 2,40 - 2,33 (4H, m), 2,32 (3H, s), 2,26 (1H, dd), 1,87 - 1,85 (1H, m), 1,12 - 1,06 (6H, m).
T185		δ _H 7,19 - 7,16 (2H, m), 6,97 - 6,90 (4H, m), 4,71 (1H, d), 4,48 (1H, s), 2,88 (1H, dd), 2,82 - 2,78 (2H, m), 2,37 - 2,30 (4H, m), 2,28 (3H, s), 2,05 (1H, dd), 1,83 - 1,77 (1H, m), 1,05 - 1,01 (6H, m).

ES 2 497 501 T3

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T186		d ₄ -MeOH δ _H 6,82 (1H, s), 6,80 (1H, s), 4,87 (1H, d), 4,77 (1H, d), 4,63 (1H, d), 2,72 (1H, d), 2,65 (1H, d), 2,23 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,07 - 2,03 (1H, m), 1,95 - 1,86 (1H, m), 1,76 - 1,70 (1H, m), 1,62 - 1,55 (1H, m).
T187		d ₄ -MeOH δ _H 8,65 (1H, s), 8,54 (1H, br. s), 8,46 (1H, br. s), 6,87 (2H, s), 4,82 (1H, d), 4,72 (1H, s), 3,48 - 3,46 (1H, m), 3,13 (1H, d), 3,04 (1H, d), 2,25 (3H, s), 2,25 - 2,18 (2H, m), 2,09 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,79 - 1,74 (1H, m), 1,72 - 1,67 (1H, m).
T188		d ₄ -MeOH δ _H 8,93 (1H, s), 8,09 - 8,06 (2H, m), 7,85 - 7,78 (2H, m), 6,87 (2H, s), 4,90 (1H, s), 4,87 (1H, d), 3,66 (1H, dd), 3,19 (1H, d), 3,09 (1H, d), 2,44 - 2,33 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,08 (3H, s).
T189		d ₄ -MeOH δ _H 7,23 (2H, s), 4,61 (2H, t), 2,88 (2H, s), 2,09 (6H, s), 1,83 (2H, m), 1,69 (2H, m)
T190		d ₄ -MeOH δ _H 7,14-7,04 (3H, m), 4,61 (2H, t), 2,88 (2H, s), 2,11 (6H, s), 1,83 (2H, m), 1,69 (2H, m)
T191		d ₄ -MeOH δ _H 7,36 (1H, dd), 7,17 (1H, d), 7,15 (1H, d), 2,81 (2H, s), 2,48 - 2,43 (2H, m), 1,84 - 1,79 (2H, m), 1,69 - 1,65 (2H, m), 1,51 (6H, s), 1,08 (3H, t).
T192		d ₄ -MeOH δ _H 6,94 (1H, d), 6,78 (1H, d), 6,73 (1H, dd), 4,59 (2H, s), 3,77 (3H, s), 2,82 (2H, s), 2,10 (3H, s), 1,84-1,79 (2H, m), 1,69-1,62 (2H, m).
T193		d ₄ -MeOH δ _H 7,84 (1H, br. s), 6,78 (2H, s), 4,89 (1H, br. s), 4,84 (1H, s), 3,28 (1H, br. s), 3,02 (1H, br. s), 2,94 (1H, br. s), 2,57 - 2,46 (2H, m), 2,53 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,03 (3H, s), 2,02 (3H, s).
T194		d ₄ -MeOH δ _H 8,09 - 8,06 (1H, m), 8,00 - 7,98 (1H, m), 7,73 - 7,70 (2H, m), 6,86 (2H, s), 4,99 (1H, s), 4,80 (1H, d), 3,19 - 3,10 (3H, m), 2,49 - 2,43 (1H, m), 2,34 - 2,28 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,46 (3H, t).
T195		d ₄ -MeOH δ _H 7,04 (1H, br. s), 6,86 (2H, s), 5,93 (1H, br. s), 4,86 (1H, br. s), 4,78 (1H, s), 3,18 (1H, br. s), 3,02 (1H, br. s), 2,94 (1H, br. s), 2,59 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,07 (6H, m).
T196		d ₄ -MeOH δ _H 8,79 (1H, s), 8,59 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,95 (1H, s), 4,92 (1H, d), 3,74 - 3,71 (1H, m), 2,87 (2H, m), 2,26 (2H, m), 2,18 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,07 (3H, s).

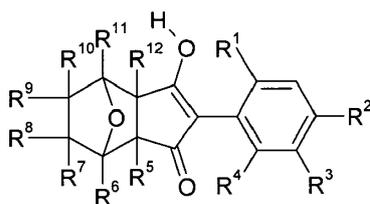
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T197		d ₄ -MeOH δ _H 7,45 - 7,42 (3H, m), 7,29 - 7,23 (2H, m), 7,17 - 7,15 (2H, m), 6,80 (2H, s), 4,82 (1H, br. s), 4,73 (1H, br. s), 3,21 (1H, br. s), 2,90 (1H, br. s), 2,84 (1H, br. s), 2,20 (3H s), 2,09 - 2,07 (2H, m), 2,05 (6H, s).
T198		d ₄ -MeOH δ _H 8,78 (1H, br. s), 7,96 (1H, br. s), 6,84 (3H, s), 4,82 (2H, br. s), 3,51 (1H br. s), 2,98 (1H, br. s), 2,90 (1H, br. s), 2,35 (1H, br. s), 2,22 (3H, s), 2,04 - 2,02 (7H, m).
T199		d ₄ -MeOH δ _H 7,81 (1H, s), 7,26 (1H, s), 6,92 (1H, s), 6,90 (1H, s), 4,91 (1H, d), 4,64 (1H, s), 3,19 - 3,17 (1H, m), 2,99 - 2,95 (2H, m), 2,32 - 2,27 (1H, m), 2,26 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,93 - 1,90 (1H, m).
T200		d ₄ -MeOH δ _H 7,95 (1H, br. s), 7,86 (1H, br. s), 7,44 (1H, br. s), 6,88 (1H, s), 6,84 (1H, s), 4,86 (1H, br. s), 4,71 (1H, br. s), 3,44 - 3,40 (1H, br. s), 3,0,7 (1H, br. s), 2,85 (1H, br. s), 2,22 (3H, s), 2,15 - 2,11 (2H, m), 2,10 (3H, s), 2,05 (3H, s).
T201		d ₄ -MeOH δ _H 7,79 (1H, t), 7,53 (2H, d), 6,86 (2H, s), 4,78 (1H, s), 4,71 (1H, s), 3,35 - 3,31 (1H, m), 2,88 (1H, br. s), 2,79 (1H, br. s), 2,22 (3H, s), 2,17 - 2,09 (2H, m), 2,04 (3H, s), 2,02 (3H, s).
T202		d ₄ -MeOH δ _H 8,76 (1H, br. s), 8,61 (1H, d), 8,32 (1H, d), 7,96 (1H, d), 7,85 (1H, d), 6,86 (2H, s), 4,84 (1H, s), 4,11 (1H, dd), 3,24 (1H, d), 3,13 (1H, d), 2,58 - 2,54 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,07 (6H, s), 1,95 - 1,91 (1H, m).
T203		d ₄ -MeOH δ _H 9,07 (1H, s), 8,38 (1H, s), 6,87 (2H, s), 4,77 (1H, s), 3,77 - 3,74 (1H, m), 3,04 (2H, br. s), 2,40 - 2,37 (1H, m), 2,29 - 2,25 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,06 (3H, s), 2,04 (3H, s).
T204		d ₄ -MeOH δ _H 6,85 (2H, s), 6,72 (1H, d), 5,03 (1H, d), 3,96 (1H, s), 2,92 - 2,88 (2H, m), 2,24 (3H, s), 2,06 (3H, s), 2,01 (3H, s).
T205		d ₆ -DMSO δ _H 11,92 (1H, s), 7,05 (1H, d), 6,96 (1H, d), 6,77 (1H, s), 4,50 (2H, s), 2,74 (2H, br. s), 2,23 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,71-1,65 (2H, m), 1,57-1,53 (2H, m).
T206		d ₆ -DMSO δ _H 12,21 (1H, s), 7,20 (1H, dd), 6,99 (1H, td), 6,75 (1H, dd), 4,51 (2H, s), 2,76 (2H, br. s), 2,04 (3H, s), 1,71-1,65 (2H, m), 1,60-1,52 (2H, m).
T207		d ₆ -DMSO δ _H 12,27 (1H, s), 7,21 (2H, s), 6,97 (1H, s), 4,51 (2H, s), 2,78 (2H, br. s), 2,05 (3H, s), 1,73-1,63 (2H, m), 1,60-1,51 (2H, m).
T208		d ₄ -MeOH δ _H 6,61 (2H, s), 4,64-4,50 (2H, m), 3,74 (3H, s), 2,83 (2H, s), 2,04 (6H, d), 1,87-1,77 (2H, m), 1,70-1,59 (2H, m).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T209		d ₄ -MeOH δ _H 8,30 (1H, s), 6,86 (2H, s), 4,89 (1H, s), 4,73 (1H, d), 3,47 (1H, dd), 3,09 (1H, d), 3,04 (1H, d), 2,55 (3H, s), 2,39 - 2,35 (1H, m), 2,30 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,17 (1H, dd), 2,06 (3H, s), 2,04 (3H, s).
T210		d ₄ -MeOH δ _H 8,72 (1H, d), 7,72 (1H, s), 7,58 (1H, d), 6,86 (2H, s), 4,81 (1H, d), 4,68 (1H, s), 3,51 (1H, dd), 3,10 (1H, d), 3,03 (1H, d), 2,33 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,16 - 2,11 (1H, m), 2,06 (3H, s), 2,05 (3H, s).
T211		d ₄ -MeOH δ _H 7,21 - 7,19 (1H, m), 6,92 - 6,90 (2H, m), 6,86 (2H, s), 4,72 (1H, d), 4,43 (1H, s), 3,49 (1H, dd), 3,02 (1H, d), 2,93 (1H, d), 2,29 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,05 (6H, s), 1,98 - 1,93 (1H, m).
T212		d ₄ -MeOH δ _H 7,41 (1H, d), 7,29 (1H, dd), 7,19 (1H, d), 4,65 - 4,60 (2H, m), 2,87 (2H, s), 1,86-1,79 (2H, m), 1,70-1,63 (2H, m).
T213		d ₄ -MeOH δ _H 7,44 - 7,41 (2H, m), 7,08 (2H, t), 6,88 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,89 (1H, s), 4,73 (1H, s), 3,68 (1H, d), 3,59 (1H, d), 3,10 - 3,06 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,5 (3H, s).
T214		d ₄ -MeOH δ _H 8,24 (2H, d), 7,66 (2H, d), 6,88 (2H, s), 4,93 (1H, s), 4,68 (1H, s), 3,76 (2H, s), 3,13 - 3,11 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,05 (3H, s).
T215		d ₄ -MeOH δ _H 7,34 - 7,30 (1H, m), 7,25 - 7,18 (2H, m), 6,89 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,90 (1H, s), 4,75 (1H, s), 3,67 (1H, d), 3,58 (1H, d), 3,10 - 3,05 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,05 (3H, s).
T216		d ₄ -MeOH δ _H 8,53 (1H, s), 7,83 (1H, d), 7,64 (1H, d), 6,91 (2H, s), 3,12 (1H, dd), 2,97 (2H, br. s), 2,47 (1H, dd), 2,27 (3H, s), 1,84 - 1,79 (1H, m), 2,11 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,71 (3H, s), 1,10 (3H, s).
T217		d ₄ -MeOH δ _H 7,92 (1H, d), 7,77 - 7,73 (1H, m), 6,91 - 6,88 (3H, m), 3,04 (1H, dd), 2,96 - 2,92 (2H, m), 2,43 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,76 (1H, dd), 1,70 (3H, s), 1,09 (3H, s).
T218		d ₄ -MeOH δ _H 7,41 (1H, d), 6,88 (2H, s), 6,35 - 6,34 (1H, m), 6,14 (1H, d), 4,72 (1H, d), 4,59 (1H, s), 3,26 (1H, dd), 3,02 (1H, d), 2,94 (1H, d), 2,27 (3H, s), 2,18 - 2,12 (1H, m), 2,08 (3H, s), 2,06 (3H, s), 2,05 - 2,01 (1H, m).
T219		d ₄ -MeOH δ _H 7,60 (1H, d), 7,06 (1H, d), 6,89 (2H, s), 4,79 (1H, d), 4,47 (1H, s), 3,63 (1H, dd), 3,06 (1H, d), 3,00 (1H, d), 2,36 (1H, dd), 2,27 (3H, s), 2,07 (6H, s), 1,97 - 1,91 (1H, m).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
T220		δ_H 7,39 (1H, dd), 7,27-7,33 (1H, m), 6,97 (1H, dd), 4,68 (2H, m), 2,74 (2H, br. s), 2,48 (2H, q), 1,78-1,87 (2H, m), 1,56 (2H, m), 1,11 (3H, t).
T221		δ_H 7,05-6,99 (1H, m), 4,76-4,67 (2H, m), 2,84 (2H, br. s), 2,38 (3H, s), 2,24 (3H, d), 2,05 (3H, d), 1,88-1,85 (2H, m), 1,64-1,58 (2H, m).
T222		d_4 -MeOH δ_H 8,11 (2H, dd), 8,61 (2H, t), 6,86 (2H, s), 4,81 (1H, s), 4,67 (1H, d), 3,81 (1H, dd), 3,14 (1H, d), 3,03 (1H, d), 2,24 (3H, s), 2,23 - 2,19 (1H, m), 2,11 - 2,09 (1H, m), 2,06 (3H, s), 2,02 (3H, s).
T223		d_4 -MeOH δ_H 7,39 - 7,36 (2H, m), 6,98 - 6,94 (2H, m), 6,88 (1H, s), 6,86 (1H, s), 4,95 (1H, s), 4,53 (1H, s), 3,63 (1H, d), 3,08 (1H, d), 3,03 (1H, d), 2,88 - 2,86 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,06 (3H, s).
T224		d_4 -MeOH δ_H 7,81 - 7,76 (1H, m), 7,73 - 7,70 (1H, m), 7,29 - 7,23 (1H, m), 6,88 (2H, s), 4,96 (1H, s), 4,79 (1H, d), 3,47 (1H, dd), 3,04 - 2,92 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,11 - 2,07 (1H, m), 2,07 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,96 - 1,88 (1H, m).
T225		d_4 -MeOH δ_H 7,16 - 7,12 (1H, m), 7,01 - 6,90 (2H, m), 6,78 (1H, s), 6,76 (1H, s), 4,94 (1H, s), 4,54 (1H, s), 3,39 (1H, d), 3,12 (1H, d), 2,28 - 2,80 (2H, br. m), 2,14 (3H, s), 2,00 (3H, s), 1,96 (3H, s).
T226		d_4 -MeOH δ_H 7,43 (1H, s), 7,38 (1H, s), 6,88 (2H, s), 6,42 (1H, d), 4,93 (1H, s), 4,71 (1H, d), 3,09 (1H, dd), 2,99 (1H, d), 2,93 (1H, d), 2,27 (3H, s), 2,17 (1H, dd), 2,08 (6H, m), 1,85 - 1,80 (1H, m).
T227		δ_H 7,92 - 7,81 (3H, m), 7,42 - 7,29 (2H, m), 6,85 (2H, s), 4,78 (1H, d), 4,59 (1H, s), 3,57 (1H, dd), 3,14 (1H, d), 3,00 (1H, d), 2,31 (1H, dd), 2,24 (3H, s), 2,07 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,04 - 1,98 (1H, m).
T228		δ_H 6,86 (2H, s), 6,47 (2H, s), 5,01 (2H, s), 2,74 (2H, s), 2,23 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,06 (3H, s).
T229		δ_H 6,65 (2H, s), 6,26 (1H, s), 4,75 (1H, s), 4,67 (1H, s), 2,62 (1H, d), 2,52 (1H, d), 2,03 (3H, s), 1,84 (3H, s), 1,80 (3H, s), 0,00 (9H, s).

Los compuestos de las siguientes Tablas 1 a 146 se pueden obtener de una manera análoga.

La Tabla 1 cubre compuestos de fórmula (A)



(I)

en la que R¹, R² y R⁴ son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno, y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹ son como se definen en la Tabla 1.

Tabla 1

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.001	H	H	H	H	H	H
1.002	H	H	H	H	H	CH ₃
1.003	H	H	H	H	H	CH ₂ OH
1.004	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₃
1.005	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
1.006	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
1.007	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
1.007	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CO ₂ CH ₃
1.008	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
1.009	H	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CN
1.010	H	H	H	H	H	CH(OH)CH ₃
1.011	H	H	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃
1.012	H	H	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₂ CH ₃
1.013	H	H	H	H	H	CHO
1.014	H	H	H	H	H	COCH ₃
1.015	H	H	H	H	H	CH ₂ COCH ₃
1.016	H	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ COCH ₃
1.017	H	H	H	H	H	CO ₂ H
1.018	H	H	H	H	H	CO ₂ CH ₃
1.019	H	H	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃
1.020	H	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃
1.021	H	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
1.022	H	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
1.023	H	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
1.024	H	H	H	H	H	CONH ₂
1.025	H	H	H	H	H	CONHCH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.026	H	H	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃
1.027	H	H	H	H	H	CON(CH ₃) ₂
1.030	H	H	H	H	H	CON(CH ₂ CH ₃) ₂
1.031	H	H	H	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃
1.032	H	H	H	H	H	CH=NOH
1.033	H	H	H	H	H	CH=NOCH ₃
1.034	H	H	H	H	H	CH=NOCH ₂ CH ₃
1.035	H	H	H	H	H	C(CH ₃)=NOH
1.036	H	H	H	H	H	C(CH ₃)=NOCH ₃
1.037	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)CH ₃
1.038	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)CH ₂ CH ₃
1.039	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)CH(CH ₃) ₂
1.040	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)C(CH ₃) ₃
1.039	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHCH ₃
1.040	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₃
1.041	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
1.042	H	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHC(CH ₃) ₃
1.043	H	H	H	H	H	CH ₂ NH ₂
1.044	H	H	H	H	H	CH ₂ NHCHO
1.045	H	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃
1.046	H	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃
1.047	H	H	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃
1.048	H	H	H	H	H	NHCO ₂ C(CH ₃) ₃
1.049	H	H	H	H	H	CN
1.050	H	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₃
1.051	H	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃
1.052	H	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CH ₃
1.053	H	H	H	H	H	CH ₂ SCH(CH ₃) ₂
1.054	H	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃
1.055	H	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃
1.056	H	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃
1.057	H	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃
1.058	H	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃
1.059	H	H	H	H	H	OCH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.060	H	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃
1.061	H	H	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂
1.062	H	H	H	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂
1.063	H	H	H	H	H	1,3-dioxofan-2-ilo
1.064	H	H	H	H	H	1,3-dioxan-2-ilo
1.065	H	H	H	H	H	5,5-dimetil-1,3-dioxan-2-ilo
1.066	H	H	H	H	H	CH ₂ CH ₃
1.067	H	H	H	H	H	<i>n</i> -propilo
1.068	H	H	H	H	H	isopropilo
1.069	H	H	H	H	H	<i>n</i> -butilo
1.070	H	H	H	H	H	isobutilo
1.071	H	H	H	H	H	sec-butilo
1.072	H	H	H	H	H	terc-butilo
1.073	H	H	H	H	H	<i>n</i> -pentilo
1.074	H	H	H	H	H	neopentilo
1.075	H	H	H	H	H	<i>n</i> -hexilo
1.076	H	H	H	H	H	<i>n</i> -heptilo
1.077	H	H	H	H	H	CH ₂ CN
1.078	H	H	H	H	H	ciclopropilo
1.079	H	H	H	H	H	ciclobutilo
1.080	H	H	H	H	H	ciclopentilo
1.081	H	H	H	H	H	ciclohexilo
1.082	H	H	H	H	H	CH ₂ -ciclopropilo
1.083	H	H	H	H	H	bencilo
1.084	H	H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
1.085	H	H	H	H	H	CH ₂ F
1.086	H	H	H	H	H	CHF ₂
1.087	H	H	H	H	H	CF ₃
1.088	H	H	H	H	CH ₃	H
1.089	H	H	H	H	CH ₂ CH ₃	H
1.090	H	H	H	H	<i>n</i> -propilo	H
1.091	H	H	H	H	isopropilo	H
1.092	H	H	H	H	<i>n</i> -butilo	H
1.093	H	H	H	H	isobutilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.094	H	H	H	H	<i>sec</i> -butilo	H
1.095	H	H	H	H	<i>terc</i> -butilo	H
1.096	H	H	H	H	vinilo	H
1.097	H	H	H	H	etinilo	H
1.098	H	H	H	H	trimetilsilietinilo	H
1.099	H	H	H	H	CH ₂ OH	H
1.100	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₃	H
1.101	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
1.102	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	H
1.103	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
1.104	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
1.105	H	H	H	H	CHO	H
1.106	H	H	H	H	COCH ₃	H
1.107	H	H	H	H	CO ₂ H	H
1.108	H	H	H	H	CO ₂ CH ₃	H
1.109	H	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H
1.110	H	H	H	H	CONH ₂	H
1.111	H	H	H	H	CONHCH ₃	H
1.112	H	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃	H
1.113	H	H	H	H	CON(CH ₃) ₂	H
1.114	H	H	H	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	H
1.115	H	H	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃	H
1.116	H	H	H	H	CH=NOH	H
1.117	H	H	H	H	CH=N-OCH ₃	H
1.118	H	H	H	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	H
1.119	H	H	H	H	C(CH ₃)=N-OH	H
1.120	H	H	H	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H
1.121	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	H
1.122	H	H	H	H	CH ₂ NH ₂	H
1.123	H	H	H	H	CH ₂ NHCHO	H
1.124	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	H
1.125	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	H
1.126	H	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H
1.127	H	H	H	H	NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.128	H	H	H	H	CH(OH)CH ₃	H
1.129	H	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	H
1.130	H	H	H	H	CN	H
1.131	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₃	H
1.132	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃	H
1.133	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
1.134	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H
1.135	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	H
1.136	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	H
1.137	H	H	H	H	OCH ₃	H
1.138	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	H
1.139	H	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂	H
1.140	H	H	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	H
1.141	H	H	H	H	ciclopropilo	H
1.142	H	H	H	H	ciclobutilo	H
1.143	H	H	H	H	ciclopentilo	H
1.144	H	H	H	H	ciclohexilo	H
1.145	H	H	H	H	F	H
1.146	H	H	H	H	Cl	H
1.147	H	H	H	H	Br	H
1.148	H	H	H	H	I	H
1.149	H	H	H	H	OH	H
1.150	H	H	H	H	fenilo	H
1.151	H	H	H	H	2-acetilfenilo	H
1.152	H	H	H	H	3-acetilfenilo	H
1.153	H	H	H	H	4-acetilfenilo	H
1.154	H	H	H	H	2-clorofenilo	H
1.155	H	H	H	H	3-clorofenilo	H
1.156	H	H	H	H	4-clorofenilo	H
1.157	H	H	H	H	2-cianofenilo	H
1.158	H	H	H	H	3-cianofenilo	H
1.159	H	H	H	H	4-cianofenilo	H
1.160	H	H	H	H	2-fluorofenilo	H
1.161	H	H	H	H	3-fluorofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.162	H	H	H	H	4-fluorofenilo	H
1.163	H	H	H	H	2-metoxifenilo	H
1.164	H	H	H	H	3-metoxifenilo	H
1.165	H	H	H	H	4-metoxifenilo	H
1.166	H	H	H	H	2-metilfenilo	H
1.167	H	H	H	H	3-metilfenilo	H
1.168	H	H	H	H	4-metilfenilo	H
1.169	H	H	H	H	2-nitrofenilo	H
1.170	H	H	H	H	3-nitrofenilo	H
1.171	H	H	H	H	4-nitrofenilo	H
1.172	H	H	H	H	2-tiometilfenilo	H
1.173	H	H	H	H	3-tiometilfenilo	H
1.174	H	H	H	H	4-tiometilfenilo	H
1.175	H	H	H	H	2-trifluorometoxifenilo	H
1.176	H	H	H	H	3-trifluorometoxifenilo	H
1.177	H	H	H	H	4-trifluorometoxifenilo	H
1.178	H	H	H	H	2-trifluorometilfenilo	H
1.179	H	H	H	H	3-trifluorometilfenilo	H
1.180	H	H	H	H	4-trifluorometilfenilo	H
1.181	H	H	H	H	2,3-diclorofenilo	H
1.182	H	H	H	H	2,4-diclorofenilo	H
1.183	H	H	H	H	2,5-diclorofenilo	H
1.184	H	H	H	H	2,6-diclorofenilo	H
1.185	H	H	H	H	3,4-diclorofenilo	H
1.186	H	H	H	H	3,5-diclorofenilo	H
1.187	H	H	H	H	2,3-difluorofenilo	H
1.188	H	H	H	H	2,4-difluorofenilo	H
1.189	H	H	H	H	2,5-difluorofenilo	H
1.190	H	H	H	H	2,6-difluorofenilo	H
1.191	H	H	H	H	3,4-difluorofenilo	H
1.192	H	H	H	H	3,5-difluorofenilo	H
1.193	H	H	H	H	2,4,6-trifluorofenilo	H
1.194	H	H	H	H	2,4-dimetilfenilo	H
1.195	H	H	H	H	2,4,6-trimetilfenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.196	H	H	H	H	3,4,5-trimetoxifenilo	h
1.197	H	H	H	H	2-cloro-3-cianofenilo	H
1.198	H	H	H	H	2-cloro-4-cianofenilo	H
1.199	H	H	H	H	2-cloro-5-cianofenilo	H
1.200	H	H	H	H	2-cloro-6-cianofenilo	H
1.201	H	H	H	H	3-cloro-2-cianofenilo	H
1.202	H	H	H	H	3-cloro-4-cianofenilo	H
1.203	H	H	H	H	3-cloro-5-cianofenilo	H
1.204	H	H	H	H	5-cloro-2-cianofenilo	H
1.205	H	H	H	H	4-cloro-2-cianofenilo	H
1.206	H	H	H	H	4-cloro-3-cianofenilo	H
1.207	H	H	H	H	2-cloro-3-fluorofenilo	H
1.208	H	H	H	H	2-cloro-4-fluorofenilo	H
1.209	H	H	H	H	2-cloro-5-fluorofenilo	H
1.210	H	H	H	H	2-cloro-6-fluorofenilo	H
1.211	H	H	H	H	3-cloro-2-fluorofenilo	H
1.212	H	H	H	H	3-cloro-4-fluorofenilo	H
1.213	H	H	H	H	3-cloro-5-fluorofenilo	H
1.214	H	H	H	H	5-cloro-2-fluorofenilo	H
1.215	H	H	H	H	4-cloro-2-fluorofenilo	H
1.216	H	H	H	H	4-cloro-3-fluorofenilo	H
1.217	H	H	H	H	2-cloro-3-metilfenilo	H
1.218	H	H	H	H	2-cloro-4-metilfenilo	H
1.219	H	H	H	H	2-cloro-5-metilfenilo	H
1.220	H	H	H	H	2-cloro-6-metilfenilo	H
1.221	H	H	H	H	3-cloro-2-metilfenilo	H
1.222	H	H	H	H	3-cloro-4-metilfenilo	H
1.223	H	H	H	H	3-cloro-5-metilfenilo	H
1.224	H	H	H	H	5-cloro-2-metilfenilo	H
1.225	H	H	H	H	4-cloro-2-metilfenilo	H
1.226	H	H	H	H	4-cloro-3-metilfenilo	H
1.227	H	H	H	H	2-ciano-3-fluorofenilo	H
1.228	H	H	H	H	2-ciano-4-fluorofenilo	H
1.229	H	H	H	H	2-ciano-5-fluorofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.230	H	H	H	H	2-ciano-6-fluorofenilo	H
1.231	H	H	H	H	3-ciano-2-fluorofenilo	H
1.232	H	H	H	H	3-ciano-4-fluorofenilo	H
1.233	H	H	H	H	3-ciano-5-fluorofenilo	H
1.234	H	H	H	H	5-ciano-2-fluorofenilo	H
1.235	H	H	H	H	4-ciano-2-fluorofenilo	H
1.236	H	H	H	H	4-ciano-3-fluorofenilo	H
1.237	H	H	H	H	2-fluoro-3-metilfenilo	H
1.238	H	H	H	H	2-fluoro-4-metilfenilo	H
1.239	H	H	H	H	2-fluoro-5-metilfenilo	H
1.240	H	H	H	H	2-fluoro-6-metilfenilo	H
1.241	H	H	H	H	3-fluoro-2-metilfenilo	H
1.242	H	H	H	H	3-fluoro-4-metilfenilo	H
1.243	H	H	H	H	3-fluoro-5-metilfenilo	H
1.244	H	H	H	H	5-fluoro-2-metilfenilo	H
1.245	H	H	H	H	4-fluoro-2-metilfenilo	H
1.246	H	H	H	H	4-fluoro-3-metilfenilo	H
1.247	H	H	H	H	piridin-2-ilo	H
1.248	H	H	H	H	piridin-3-ilo	H
1.249	H	H	H	H	piridin-ilo	H
1.250	H	H	H	H	3-cloropiridin-2-ilo	H
1.251	H	H	H	H	4-cloropiridin-2-ilo	H
1.252	H	H	H	H	5-cloropiridin-2-ilo	H
1.253	H	H	H	H	6-cloropiridin-2-ilo	H
1.254	H	H	H	H	2-cloropiridin-3-ilo	H
1.255	H	H	H	H	4-cloropiridin-3-ilo	H
1.256	H	H	H	H	5-cloropiridin-3-ilo	H
1.257	H	H	H	H	2-cloropiridin-4-ilo	H
1.258	H	H	H	H	3-cloropiridin-4-ilo	H
1.259	H	H	H	H	2-cloropiridin-5-ilo	H
1.260	H	H	H	H	3-cianopiridin-2-ilo	H
1.261	H	H	H	H	4-cianopiridin-2-ilo	H
1.262	H	H	H	H	5-cianopiridin-2-ilo	H
1.263	H	H	H	H	6-cianopiridin-2-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.264	H	H	H	H	2-cianopiridin-3-ilo	H
1.265	H	H	H	H	4-cianopiridin-3-ilo	H
1.266	H	H	H	H	5-cianopiridin-3-ilo	H
1.267	H	H	H	H	2-cianopiridin-5-ilo	H
1.268	H	H	H	H	3-fluoropiridin-2-ilo	H
1.269	H	H	H	H	4-fluoropiridin-2-ilo	H
1.270	H	H	H	H	5-fluoropiridin-2-ilo	H
1.271	H	H	H	H	6-fluoropiridin-2-ilo	H
1.272	H	H	H	H	2-fluoropiridin-3-ilo	H
1.273	H	H	H	H	4-fluoropiridin-3-ilo	H
1.274	H	H	H	H	5-fluoropiridin-3-ilo	H
1.275	H	H	H	H	2-fluoropiridin-5-ilo	H
1.276	H	H	H	H	3-nitropiridin-2-ilo	H
1.277	H	H	H	H	4-nitropiridin-2-ilo	H
1.278	H	H	H	H	5-nitropiridin-2-ilo	H
1.279	H	H	H	H	6-nitropiridin-2-ilo	H
1.280	H	H	H	H	2-nitropiridin-3-ilo	H
1.281	H	H	H	H	4-nitropiridin-3-ilo	H
1.282	H	H	H	H	5-nitropiridin-3-ilo	H
1.283	H	H	H	H	2-nitropiridin-5-ilo	H
1.284	H	H	H	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.285	H	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.286	H	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.287	H	H	H	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.288	H	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
1.289	H	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
1.290	H	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
1.291	H	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	H
1.292	H	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-3-ilo	H
1.293	H	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-4-ilo	H
1.294	H	H	H	H	3,5-bis(trifluorometil)- piridin-2-ilo	H
1.295	H	H	H	H	2-tienilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.296	H	H	H	H	3-tienilo	H
1.297	H	H	H	H	5-cianotien-2-ilo	H
1.298	H	H	H	H	2-furilo	H
1.299	H	H	H	H	3-furilo	H
1.300	H	H	H	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	H
1.301	H	H	H	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	H
1.302	H	H	H	H	5-metil-2-metil-tiopirimidin-4-ilo	H
1.303	H	H	H	H	pirazin-2-ilo	H
1.304	H	H	H	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	H
1.305	H	H	H	H	3-cianopirazin-2-ilo	H
1.306	H	H	H	H	quinolin-2-ilo	H
1.307	H	H	H	H	3-etilquinolin-2-ilo	H
1.308	H	H	H	H	bencilo	H
1.309	H	H	H	H	4-fluorobencilo	H
1.310	H	H	H	H	4-clorobencilo	H
1.311	H	H	H	H	4-metilbencilo	H
1.312	H	H	H	H	2,4-dimetilbencilo	H
1.313	H	H	H	H	2,4,6-trimetilbencilo	H
1.314	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃
1.315	H	H	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.316	H	H	H	H	<i>n</i> -propilo	CH ₃
1.317	H	H	H	H	isopropilo	CH ₃
1.318	H	H	H	H	<i>n</i> -butilo	CH ₃
1.319	H	H	H	H	isobutilo	CH ₃
1.320	H	H	H	H	<i>sec</i> -butilo	CH ₃
1.321	H	H	H	H	<i>terc</i> -butilo	CH ₃
1.322	H	H	H	H	vinilo	CH ₃
1.323	H	H	H	H	etinilo	CH ₃
1.324	H	H	H	H	trimetilsililetinilo	CH ₃
1.325	H	H	H	H	CH ₂ OH	CH ₃
1.326	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
1.327	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.328	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	CH ₃
1.329	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.330	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
1.331	H	H	H	H	CHO	CH ₃
1.332	H	H	H	H	COCH ₃	CH ₃
1.333	H	H	H	H	CO ₂ H	CH ₃
1.337	H	H	H	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃
1.335	H	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.336	H	H	H	H	CONH ₂	CH ₃
1.337	H	H	H	H	CONHCH ₃	CH ₃
1.338	H	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.339	H	H	H	H	CON(CH ₃) ₂	CH ₃
1.340	H	H	H	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	CH ₃
1.341	H	H	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
1.342	H	H	H	H	CH=NOH	CH ₃
1.343	H	H	H	H	CH=N-OCH ₃	CH ₃
1.344	H	H	H	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.345	H	H	H	H	C(CH ₃)=N-OH	CH ₃
1.346	H	H	H	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃
1.347	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	CH ₃
1.348	H	H	H	H	CH ₂ NH ₂	CH ₃
1.349	H	H	H	H	CH ₂ NHCHO	CH ₃
1.350	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	CH ₃
1.351	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃
1.352	H	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃	CH ₃
1.353	H	H	H	H	NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
1.354	H	H	H	H	CH(OH)CH ₃	CH ₃
1.355	H	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
1.356	H	H	H	H	CN	CH ₃
1.357	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃
1.358	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃
1.359	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃
1.360	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.361	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.362	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.363	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.364	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.365	H	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂	CH ₃
1.366	H	H	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃
1.367	H	H	H	H	ciclopropilo	CH ₃
1.368	H	H	H	H	ciclobutilo	CH ₃
1.369	H	H	H	H	ciclopentilo	CH ₃
1.370	H	H	H	H	ciclohexilo	CH ₃
1.371	H	H	H	H	F	CH ₃
1.372	H	H	H	H	Cl	CH ₃
1.373	H	H	H	H	Br	CH ₃
1.374	H	H	H	H	I	CH ₃
1.375	H	H	H	H	OH	CH ₃
1.376	H	H	H	H	fenilo	CH ₃
1.377	H	H	H	H	2-acetilfenilo	CH ₃
1.378	H	H	H	H	3-acetilfenilo	CH ₃
1.379	H	H	H	H	4-acetilfenilo	CH ₃
1.380	H	H	H	H	2-clorofenilo	CH ₃
1.381	H	H	H	H	3-clorofenilo	CH ₃
1.382	H	H	H	H	4-clorofenilo	CH ₃
1.383	H	H	H	H	2-cianofenilo	CH ₃
1.384	H	H	H	H	3-cianofenilo	CH ₃
1.385	H	H	H	H	4-cianofenilo	CH ₃
1.386	H	H	H	H	2-fluorofenilo	CH ₃
1.387	H	H	H	H	3-fluorofenilo	CH ₃
1.388	H	H	H	H	4-fluorofenilo	CH ₃
1.389	H	H	H	H	2-metoxifenilo	CH ₃
1.390	H	H	H	H	3-metoxifenilo	CH ₃
1.391	H	H	H	H	4-metoxifenilo	CH ₃
1.392	H	H	H	H	2-metilfenilo	CH ₃
1.393	H	H	H	H	3-metilfenilo	CH ₃
1.394	H	H	H	H	4-metilfenilo	CH ₃
1.395	H	H	H	H	2-nitrofenilo	CH ₃
1.396	H	H	H	H	3-nitrofenilo	CH ₃
1.397	H	H	H	H	4-nitrofenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.398	H	H	H	H	2-tiometilfenilo	CH ₃
1.399	H	H	H	H	3-tiometilfenilo	CH ₃
1.400	H	H	H	H	4-tiometilfenilo	CH ₃
1.401	H	H	H	H	2-trifluorometoxifenilo	CH ₃
1.402	H	H	H	H	3-trifluorometoxifenilo	CH ₃
1.403	H	H	H	H	4-trifluorometoxifenilo	CH ₃
1.404	H	H	H	H	2-trifluorometilfenilo	CH ₃
1.405	H	H	H	H	3-trifluorometilfenilo	CH ₃
1.406	H	H	H	H	4-trifluorometilfenilo	CH ₃
1.407	H	H	H	H	2,3-diclorofenilo	CH ₃
1.408	H	H	H	H	2,4-diclorofenilo	CH ₃
1.409	H	H	H	H	2,5-diclorofenilo	CH ₃
1.410	H	H	H	H	2,6-diclorofenilo	CH ₃
1.411	H	H	H	H	3,4-diclorofenilo	CH ₃
1.412	H	H	H	H	3,5-diclorofenilo	CH ₃
1.413	H	H	H	H	2,3-difluorofenilo	CH ₃
1.414	H	H	H	H	2,4-difluorofenilo	CH ₃
1.415	H	H	H	H	2,5-difluorofenilo	CH ₃
1.416	H	H	H	H	2,6-difluorofenilo	CH ₃
1.417	H	H	H	H	3,4-difluorofenilo	CH ₃
1.418	H	H	H	H	3,5-difluorofenilo	CH ₃
1.419	H	H	H	H	2,4,6-trifluorofenilo	CH ₃
1.420	H	H	H	H	2,4-dimetilfenilo	CH ₃
1.421	H	H	H	H	2,4,6-trimetilfenilo	CH ₃
1.422	H	H	H	H	3,4,5-trimetoxifenilo	CH ₃
1.423	H	H	H	H	2-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
1.424	H	H	H	H	2-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
1.425	H	H	H	H	2-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
1.426	H	H	H	H	2-cloro-6-cianofenilo	CH ₃
1.427	H	H	H	H	3-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
1.428	H	H	H	H	3-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
1.429	H	H	H	H	3-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
1.430	H	H	H	H	5-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
1.431	H	H	H	H	4-cloro-2-cianofenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.432	H	H	H	H	4-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
1.433	H	H	H	H	2-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
1.434	H	H	H	H	2-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
1.435	H	H	H	H	2-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
1.436	H	H	H	H	2-cloro-6-fluorofenilo	CH ₃
1.437	H	H	H	H	3-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
1.438	H	H	H	H	3-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
1.439	H	H	H	H	3-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
1.440	H	H	H	H	5-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
1.441	H	H	H	H	4-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
1.442	H	H	H	H	4-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
1.443	H	H	H	H	2-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
1.444	H	H	H	H	2-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
1.445	H	H	H	H	2-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
1.446	H	H	H	H	2-cloro-6-metilfenilo	CH ₃
1.447	H	H	H	H	3-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
1.448	H	H	H	H	3-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
1.449	H	H	H	H	3-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
1.450	H	H	H	H	5-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
1.451	H	H	H	H	4-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
1.452	H	H	H	H	4-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
1.453	H	H	H	H	2-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
1.454	H	H	H	H	2-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
1.455	H	H	H	H	2-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
1.456	H	H	H	H	2-ciano-6-fluorofenilo	CH ₃
1.457	H	H	H	H	3-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
1.458	H	H	H	H	3-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
1.459	H	H	H	H	3-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
1.460	H	H	H	H	5-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
1.461	H	H	H	H	4-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
1.462	H	H	H	H	4-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
1.463	H	H	H	H	2-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
1.464	H	H	H	H	2-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
1.465	H	H	H	H	2-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.466	H	H	H	H	2-fluoro-6-metilfenilo	CH ₃
1.467	H	H	H	H	3-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
1.468	H	H	H	H	3-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
1.469	H	H	H	H	3-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
1.470	H	H	H	H	5-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
1.471	H	H	H	H	4-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
1.472	H	H	H	H	4-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
1.473	H	H	H	H	piridin-2-ilo	CH ₃
1.474	H	H	H	H	piridin-3-ilo	CH ₃
1.475	H	H	H	H	piridin-4-ilo	CH ₃
1.476	H	H	H	H	3-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.477	H	H	H	H	4-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.478	H	H	H	H	5-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.479	H	H	H	H	6-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.480	H	H	H	H	2-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
1.481	H	H	H	H	4-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
1.482	H	H	H	H	5-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
1.483	H	H	H	H	2-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
1.484	H	H	H	H	3-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
1.485	H	H	H	H	2-cloropiridin-5-ilo	CH ₃
1.486	H	H	H	H	3-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.487	H	H	H	H	4-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.488	H	H	H	H	5-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.489	H	H	H	H	6-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.490	H	H	H	H	2-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
1.491	H	H	H	H	4-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
1.492	H	H	H	H	5-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
1.493	H	H	H	H	2-cianopiridin-5-ilo	CH ₃
1.494	H	H	H	H	3-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.495	H	H	H	H	4-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.496	H	H	H	H	5-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.497	H	H	H	H	6-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.498	H	H	H	H	2-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
1.499	H	H	H	H	4-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.500	H	H	H	H	5-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
1.501	H	H	H	H	2-fluoropiridin-5-ilo	CH ₃
1.502	H	H	H	H	3-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.503	H	H	H	H	4-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.504	H	H	H	H	5-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.505	H	H	H	H	6-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.506	H	H	H	H	2-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
1.507	H	H	H	H	4-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
1.508	H	H	H	H	5-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
1.509	H	H	H	H	2-nitropiridin-5-ilo	CH ₃
1.510	H	H	H	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.511	H	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.512	H	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.513	H	H	H	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.514	H	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
1.515	H	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
1.516	H	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
1.517	H	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	CH ₃
1.518	H	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-3-ilo	CH ₃
1.519	H	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-4-ilo	CH ₃
1.520	H	H	H	H	3,5-bis(trifluorometil)- piridin-2-ilo	CH ₃
1.521	H	H	H	H	2-tienilo	CH ₃
1.522	H	H	H	H	3-tienilo	CH ₃
1.523	H	H	H	H	5-cianotien-2-ilo	CH ₃
1.524	H	H	H	H	2-furilo	CH ₃
1.525	H	H	H	H	3-furilo	CH ₃
1.526	H	H	H	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	CH ₃
1.527	H	H	H	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	CH ₃
1.528	H	H	H	H	5-metil-2-metil-tiopirimidin- 4-ilo	CH ₃
1.529	H	H	H	H	pirazin-2-ilo	CH ₃
1.530	H	H	H	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	CH ₃
1.531	H	H	H	H	3-cianopirazin-2-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.532	H	H	H	H	quinolin-2-ilo	CH ₃
1.533	H	H	H	H	3-etilquinolin-2-ilo	CH ₃
1.534	H	H	H	H	bencilo	CH ₃
1.535	H	H	H	H	4-fluorobencilo	CH ₃
1.536	H	H	H	H	4-clorobencilo	CH ₃
1.537	H	H	H	H	4-metilbencilo	CH ₃
1.538	H	H	H	H	2,4-dimetilbencilo	CH ₃
1.539	H	H	H	H	2,4,6-trimetilbencilo	CH ₃
1.540	CH ₃	H	H	H	CH ₃	H
1.541	CH ₃	H	H	H	CH ₂ CH ₃	H
1.542	CH ₃	H	H	H	<i>n</i> -propilo	H
1.543	CH ₃	H	H	H	isopropilo	H
1.544	CH ₃	H	H	H	<i>n</i> -butilo	H
1.545	CH ₃	H	H	H	isobutilo	H
1.546	CH ₃	H	H	H	<i>sec</i> -butilo	H
1.547	CH ₃	H	H	H	<i>terc</i> -butilo	H
1.548	CH ₃	H	H	H	vinilo	H
1.549	CH ₃	H	H	H	etinilo	H
1.550	CH ₃	H	H	H	trimetilsililetinilo	H
1.551	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OH	H
1.552	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₃	H
1.553	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
1.554	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	H
1.555	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
1.556	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
1.557	CH ₃	H	H	H	CHO	H
1.558	CH ₃	H	H	H	COCH ₃	H
1.559	CH ₃	H	H	H	CO ₂ H	H
1.560	CH ₃	H	H	H	CO ₂ CH ₃	H
1.561	CH ₃	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H
1.562	CH ₃	H	H	H	CONH ₂	H
1.563	CH ₃	H	H	H	CONHCH ₃	H
1.564	CH ₃	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃	H
1.565	CH ₃	H	H	H	CON(CH ₃) ₂	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.566	CH ₃	H	H	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	H
1.567	CH ₃	H	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃	H
1.568	CH ₃	H	H	H	CH=NOH	H
1.569	CH ₃	H	H	H	CH=N-OCH ₃	H
1.570	CH ₃	H	H	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	H
1.571	CH ₃	H	H	H	C(CH ₃)=N-OH	H
1.572	CH ₃	H	H	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H
1.573	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	H
1.574	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NH ₂	H
1.575	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NHCHO	H
1.576	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	H
1.577	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	H
1.578	CH ₃	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H
1.579	CH ₃	H	H	H	NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	H
1.580	CH ₃	H	H	H	CH(OH)CH ₃	H
1.581	CH ₃	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	H
1.582	CH ₃	H	H	H	CN	H
1.583	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SCH ₃	H
1.584	CH ₃	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃	H
1.585	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
1.586	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H
1.587	CH ₃	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	H
1.588	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	H
1.589	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	H
1.590	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	H
1.591	CH ₃	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂	H
1.592	CH ₃	H	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	H
1.593	CH ₃	H	H	H	ciclopropilo	H
1.594	CH ₃	H	H	H	ciclobutilo	H
1.595	CH ₃	H	H	H	ciclopentilo	H
1.596	CH ₃	H	H	H	ciclohexilo	H
1.597	CH ₃	H	H	H	F	H
1.598	CH ₃	H	H	H	Cl	H
1.599	CH ₃	H	H	H	Br	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.600	CH ₃	H	H	H	I	H
1.601	CH ₃	H	H	H	OH	H
1.602	CH ₃	H	H	H	fenilo	H
1.603	CH ₃	H	H	H	2-acetilfenilo	H
1.604	CH ₃	H	H	H	3-acetilfenilo	H
1.605	CH ₃	H	H	H	4-acetilfenilo	H
1.606	CH ₃	H	H	H	2-clorofenilo	H
1.607	CH ₃	H	H	H	3-clorofenilo	H
1.608	CH ₃	H	H	H	4-clorofenilo	H
1.609	CH ₃	H	H	H	2-cianofenilo	H
1.610	CH ₃	H	H	H	3-cianofenilo	H
1.611	CH ₃	H	H	H	4-cianofenilo	H
1.612	CH ₃	H	H	H	2-fluorofenilo	H
1.613	CH ₃	H	H	H	3-fluorofenilo	H
1.614	CH ₃	H	H	H	4-fluorofenilo	H
1.615	CH ₃	H	H	H	2-metoxifenilo	H
1.616	CH ₃	H	H	H	3-metoxifenilo	H
1.617	CH ₃	H	H	H	4-metoxifenilo	H
1.618	CH ₃	H	H	H	2-metilfenilo	H
1.619	CH ₃	H	H	H	3-metilfenilo	H
1.620	CH ₃	H	H	H	4-metilfenilo	H
1.621	CH ₃	H	H	H	2-nitrofenilo	H
1.622	CH ₃	H	H	H	3-nitrofenilo	H
1.623	CH ₃	H	H	H	4-nitrofenilo	H
1.624	CH ₃	H	H	H	2-tiometilfenilo	H
1.625	CH ₃	H	H	H	3-tiometilfenilo	H
1.626	CH ₃	H	H	H	4-tiometilfenilo	H
1.627	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxifenilo	H
1.628	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxifenilo	H
1.629	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxifenilo	H
1.630	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometilfenilo	H
1.631	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometilfenilo	H
1.632	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometilfenilo	H
1.633	CH ₃	H	H	H	2,3-diclorofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.634	CH ₃	H	H	H	2,4-diclorofenilo	H
1.635	CH ₃	H	H	H	2,5-diclorofenilo	H
1.636	CH ₃	H	H	H	2,6-diclorofenilo	H
1.637	CH ₃	H	H	H	3,4-diclorofenilo	H
1.638	CH ₃	H	H	H	3,5-diclorofenilo	H
1.639	CH ₃	H	H	H	2,3-difluorofenilo	H
1.640	CH ₃	H	H	H	2,4-difluorofenilo	H
1.641	CH ₃	H	H	H	2,5-difluorofenilo	H
1.642	CH ₃	H	H	H	2,6-difluorofenilo	H
1.643	CH ₃	H	H	H	3,4-difluorofenilo	H
1.644	CH ₃	H	H	H	3,5-difluorofenilo	H
1.645	CH ₃	H	H	H	2,4,6-trifluorofenilo	H
1.646	CH ₃	H	H	H	2,4-dimetilfenilo	H
1.647	CH ₃	H	H	H	2,4,6-trimetilfenilo	H
1.648	CH ₃	H	H	H	3,4,5-trimetoxi-fenilo	H
1.649	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-cianofenilo	H
1.650	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-cianofenilo	H
1.651	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-cianofenilo	H
1.652	CH ₃	H	H	H	2-cloro-6-cianofenilo	H
1.653	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-cianofenilo	H
1.654	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-cianofenilo	H
1.655	CH ₃	H	H	H	3-cloro-5-cianofenilo	H
1.656	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-cianofenilo	H
1.657	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-cianofenilo	H
1.658	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-cianofenilo	H
1.659	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-fluorofenilo	H
1.660	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-fluorofenilo	H
1.661	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-fluorofenilo	H
1.662	CH ₃	H	H	H	2-cloro-6-fluorofenilo	H
1.663	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-fluorofenilo	H
1.664	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-fluorofenilo	H
1.665	CH ₃	H	H	H	3-cloro-5-fluorofenilo	H
1.666	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-fluorofenilo	H
1.667	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-fluorofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.668	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-fluorofenilo	H
1.669	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-metilfenilo	H
1.670	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-metilfenilo	H
1.671	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-metilfenilo	H
1.672	CH ₃	H	H	H	2-cloro-6-metilfenilo	H
1.673	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-metilfenilo	H
1.674	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-metilfenilo	H
1.675	CH ₃	H	H	H	3-cloro-5-metilfenilo	H
1.676	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-metilfenilo	H
1.677	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-metilfenilo	H
1.678	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-metilfenilo	H
1.679	CH ₃	H	H	H	2-ciano-3-fluorofenilo	H
1.680	CH ₃	H	H	H	2-ciano-4-fluorofenilo	H
1.681	CH ₃	H	H	H	2-ciano-5-fluorofenilo	H
1.682	CH ₃	H	H	H	2-ciano-6-fluorofenilo	H
1.683	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-fluorofenilo	H
1.684	CH ₃	H	H	H	3-ciano-4-fluorofenilo	H
1.685	CH ₃	H	H	H	3-ciano-5-fluorofenilo	H
1.686	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-fluorofenilo	H
1.687	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-fluorofenilo	H
1.688	CH ₃	H	H	H	4-ciano-3-fluorofenilo	H
1.689	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-3-metilfenilo	H
1.690	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-4-metilfenilo	H
1.691	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-5-metilfenilo	H
1.692	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-6-metilfenilo	H
1.693	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-metilfenilo	H
1.694	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-4-metilfenilo	H
1.695	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-5-metilfenilo	H
1.696	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-metilfenilo	H
1.697	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-metilfenilo	H
1.698	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-3-metilfenilo	H
1.699	CH ₃	H	H	H	piridin-2-ilo	H
1.700	CH ₃	H	H	H	piridin-3-ilo	H
1.701	CH ₃	H	H	H	piridin-4-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.702	CH ₃	H	H	H	3-cloropiridin-2-ilo	H
1.703	CH ₃	H	H	H	4-cloropiridin-2-ilo	H
1.704	CH ₃	H	H	H	5-cloropiridin-2-ilo	H
1.705	CH ₃	H	H	H	6-cloropiridin-2-ilo	H
1.706	CH ₃	H	H	H	2-cloropiridin-3-ilo	H
1.707	CH ₃	H	H	H	4-cloropiridin-3-ilo	H
1.708	CH ₃	H	H	H	5-cloropiridin-3-ilo	H
1.709	CH ₃	H	H	H	2-cloropiridin-4-ilo	H
1.710	CH ₃	H	H	H	3-cloropiridin-4-ilo	H
1.711	CH ₃	H	H	H	2-cloropiridin-5-ilo	H
1.712	CH ₃	H	H	H	3-cianopiridin-2-ilo	H
1.713	CH ₃	H	H	H	4-cianopiridin-2-ilo	H
1.714	CH ₃	H	H	H	5-cianopiridin-2-ilo	H
1.715	CH ₃	H	H	H	6-cianopiridin-2-ilo	H
1.716	CH ₃	H	H	H	2-cianopiridin-3-ilo	H
1.717	CH ₃	H	H	H	4-cianopiridin-3-ilo	H
1.718	CH ₃	H	H	H	5-cianopiridin-3-ilo	H
1.719	CH ₃	H	H	H	2-cianopiridin-5-ilo	H
1.720	CH ₃	H	H	H	3-fluoropiridin-2-ilo	H
1.721	CH ₃	H	H	H	4-fluoropiridin-2-ilo	H
1.722	CH ₃	H	H	H	5-fluoropiridin-2-ilo	H
1.723	CH ₃	H	H	H	6-fluoropiridin-2-ilo	H
1.724	CH ₃	H	H	H	2-fluoropiridin-3-ilo	H
1.725	CH ₃	H	H	H	4-fluoropiridin-3-ilo	H
1.726	CH ₃	H	H	H	5-fluoropiridin-3-ilo	H
1.727	CH ₃	H	H	H	2-fluoropiridin-5-ilo	H
1.728	CH ₃	H	H	H	3-nitropiridin-2-ilo	H
1.729	CH ₃	H	H	H	4-nitropiridin-2-ilo	H
1.730	CH ₃	H	H	H	5-nitropiridin-2-ilo	H
1.731	CH ₃	H	H	H	6-nitropiridin-2-ilo	H
1.732	CH ₃	H	H	H	2-nitropiridin-3-ilo	H
1.733	CH ₃	H	H	H	4-nitropiridin-3-ilo	H
1.734	CH ₃	H	H	H	5-nitropiridin-3-ilo	H
1.735	CH ₃	H	H	H	2-nitropiridin-5-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.736	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.737	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.738	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.739	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
1.740	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
1.741	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
1.742	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
1.743	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	H
1.744	CH ₃	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-3-ilo	H
1.745	CH ₃	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-4-ilo	H
1.746	CH ₃	H	H	H	3,5-bis(trifluorometil)- piridin-2-ilo	H
1.747	CH ₃	H	H	H	2-tienilo	H
1.748	CH ₃	H	H	H	3-tienilo	H
1.749	CH ₃	H	H	H	5-cianotien-2-ilo	H
1.750	CH ₃	H	H	H	2-furilo	H
1.751	CH ₃	H	H	H	3-furilo	H
1.752	CH ₃	H	H	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	H
1.753	CH ₃	H	H	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	H
1.754	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-metil-tiopirimidin- 4-ilo	H
1.755	CH ₃	H	H	H	pirazin-2-ilo	H
1.756	CH ₃	H	H	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	H
1.757	CH ₃	H	H	H	3-cianopirazin-2-ilo	H
1.758	CH ₃	H	H	H	quinolin-2-ilo	H
1.759	CH ₃	H	H	H	3-etilquinolin-2-ilo	H
1.760	CH ₃	H	H	H	bencilo	H
1.761	CH ₃	H	H	H	4-fluorobencilo	H
1.762	CH ₃	H	H	H	4-clorobencilo	H
1.763	CH ₃	H	H	H	4-metilbencilo	H
1.764	CH ₃	H	H	H	2,4-dimetilbencilo	H
1.765	CH ₃	H	H	H	2,4,6-trimetilbencilo	H
1.766	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃
1.767	CH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.768	CH ₃	H	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.769	CH ₃	H	H	H	<i>n</i> -propilo	CH ₃
1.770	CH ₃	H	H	H	isopropilo	CH ₃
1.771	CH ₃	H	H	H	<i>n</i> -butilo	CH ₃
1.772	CH ₃	H	H	H	isobutilo	CH ₃
1.773	CH ₃	H	H	H	<i>sec</i> -butilo	CH ₃
1.774	CH ₃	H	H	H	<i>terc</i> -butilo	CH ₃
1.775	CH ₃	H	H	H	vinilo	CH ₃
1.776	CH ₃	H	H	H	etinilo	CH ₃
1.777	CH ₃	H	H	H	trimetilsilietinilo	CH ₃
1.778	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OH	CH ₃
1.779	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
1.780	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.781	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	CH ₃
1.782	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.783	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
1.784	CH ₃	H	H	H	CHO	CH ₃
1.785	CH ₃	H	H	H	COCH ₃	CH ₃
1.786	CH ₃	H	H	H	CO ₂ H	CH ₃
1.787	CH ₃	H	H	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃
1.788	CH ₃	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.789	CH ₃	H	H	H	CONH ₂	CH ₃
1.790	CH ₃	H	H	H	CONHCH ₃	CH ₃
1.791	CH ₃	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.792	CH ₃	H	H	H	CON(CH ₃) ₂	CH ₃
1.793	CH ₃	H	H	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	CH ₃
1.794	CH ₃	H	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
1.795	CH ₃	H	H	H	CH=NOH	CH ₃
1.796	CH ₃	H	H	H	CH=N-OCH ₃	CH ₃
1.797	CH ₃	H	H	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.798	CH ₃	H	H	H	C(CH ₃)=N-OH	CH ₃
1.799	CH ₃	H	H	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃
1.800	CH ₃	H	H	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	CH ₃
1.801	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NH ₂	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.802	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NHCHO	CH ₃
1.803	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	CH ₃
1.804	CH ₃	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃
1.805	CH ₃	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃	CH ₃
1.806	CH ₃	H	H	H	NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
1.807	CH ₃	H	H	H	CH(OH)CH ₃	CH ₃
1.808	CH ₃	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
1.809	CH ₃	H	H	H	CN	CH ₃
1.810	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃
1.811	CH ₃	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃
1.812	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃
1.813	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.814	CH ₃	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.815	CH ₃	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
1.816	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
1.817	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	CH ₃
1.818	CH ₃	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂	CH ₃
1.819	CH ₃	H	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃
1.820	CH ₃	H	H	H	Ciclopropilo	CH ₃
1.821	CH ₃	H	H	H	Ciclobutilo	CH ₃
1.822	CH ₃	H	H	H	Ciclopentilo	CH ₃
1.823	CH ₃	H	H	H	Ciclohexilo	CH ₃
1.824	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃
1.825	CH ₃	H	H	H	Cl	CH ₃
1.826	CH ₃	H	H	H	Br	CH ₃
1.827	CH ₃	H	H	H	I	CH ₃
1.828	CH ₃	H	H	H	OH	CH ₃
1.829	CH ₃	H	H	H	fenilo	CH ₃
1.830	CH ₃	H	H	H	2-acetilfenilo	CH ₃
1.831	CH ₃	H	H	H	3-acetilfenilo	CH ₃
1.832	CH ₃	H	H	H	4-acetilfenilo	CH ₃
1.833	CH ₃	H	H	H	2-clorofenilo	CH ₃
1.834	CH ₃	H	H	H	3-clorofenilo	CH ₃
1.835	CH ₃	H	H	H	4-clorofenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.836	CH ₃	H	H	H	2-cianofenilo	CH ₃
1.837	CH ₃	H	H	H	3-cianofenilo	CH ₃
1.838	CH ₃	H	H	H	4-cianofenilo	CH ₃
1.839	CH ₃	H	H	H	2-fluorofenilo	CH ₃
1.840	CH ₃	H	H	H	3-fluorofenilo	CH ₃
1.841	CH ₃	H	H	H	4-fluorofenilo	CH ₃
1.842	CH ₃	H	H	H	2-metoxifenilo	CH ₃
1.843	CH ₃	H	H	H	3-metoxifenilo	CH ₃
1.844	CH ₃	H	H	H	4-metoxifenilo	CH ₃
1.845	CH ₃	H	H	H	2-metilfenilo	CH ₃
1.846	CH ₃	H	H	H	3-metilfenilo	CH ₃
1.847	CH ₃	H	H	H	4-metilfenilo	CH ₃
1.848	CH ₃	H	H	H	2-nitrofenilo	CH ₃
1.849	CH ₃	H	H	H	3-nitrofenilo	CH ₃
1.850	CH ₃	H	H	H	4-nitrofenilo	CH ₃
1.851	CH ₃	H	H	H	2-tiometilfenilo	CH ₃
1.852	CH ₃	H	H	H	3-tiometilfenilo	CH ₃
1.853	CH ₃	H	H	H	4-tiometilfenilo	CH ₃
1.854	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxifenilo	CH ₃
1.855	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxifenilo	CH ₃
1.856	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxifenilo	CH ₃
1.857	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometilfenilo	CH ₃
1.858	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometilfenilo	CH ₃
1.859	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometilfenilo	CH ₃
1.860	CH ₃	H	H	H	2,3-diclorofenilo	CH ₃
1.861	CH ₃	H	H	H	2,4-diclorofenilo	CH ₃
1.862	CH ₃	H	H	H	2,5-diclorofenilo	CH ₃
1.863	CH ₃	H	H	H	2,6-diclorofenilo	CH ₃
1.864	CH ₃	H	H	H	3,4-diclorofenilo	CH ₃
1.865	CH ₃	H	H	H	3,5-diclorofenilo	CH ₃
1.866	CH ₃	H	H	H	2,3-difluorofenilo	CH ₃
1.867	CH ₃	H	H	H	2,4-difluorofenilo	CH ₃
1.868	CH ₃	H	H	H	2,5-difluorofenilo	CH ₃
1.869	CH ₃	H	H	H	2,6-difluorofenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.870	CH ₃	H	H	H	3,4-difluorofenilo	CH ₃
1.871	CH ₃	H	H	H	3,5-difluorofenilo	CH ₃
1.872	CH ₃	H	H	H	2,4,6-trifluorofenilo	CH ₃
1.873	CH ₃	H	H	H	2,4-dimetilfenilo	CH ₃
1.874	CH ₃	H	H	H	2,4,6-trimetilfenilo	CH ₃
1.875	CH ₃	H	H	H	3,4,5-trimetoxifenilo	CH ₃
1.876	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
1.877	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
1.878	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
1.879	CH ₃	H	H	H	2-cloro-6-cianofenilo	CH ₃
1.880	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
1.881	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
1.882	CH ₃	H	H	H	3-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
1.883	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
1.884	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
1.885	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
1.886	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
1.887	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
1.888	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
1.889	CH ₃	H	H	H	2-cloro-6-fluorofenilo	CH ₃
1.890	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
1.891	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
1.892	CH ₃	H	H	H	3-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
1.893	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
1.894	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
1.895	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
1.896	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
1.897	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
1.898	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
1.899	CH ₃	H	H	H	2-cloro-6-metilfenilo	CH ₃
1.900	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
1.901	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
1.902	CH ₃	H	H	H	3-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
1.903	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-metilfenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.904	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
1.905	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
1.906	CH ₃	H	H	H	2-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
1.907	CH ₃	H	H	H	2-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
1.908	CH ₃	H	H	H	2-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
1.909	CH ₃	H	H	H	2-ciano-6-fluorofenilo	CH ₃
1.910	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
1.911	CH ₃	H	H	H	3-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
1.912	CH ₃	H	H	H	3-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
1.913	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
1.914	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
1.915	CH ₃	H	H	H	4-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
1.916	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
1.917	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
1.918	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
1.919	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-6-metilfenilo	CH ₃
1.920	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
1.921	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
1.922	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
1.923	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
1.924	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
1.925	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
1.926	CH ₃	H	H	H	piridin-2-ilo	CH ₃
1.927	CH ₃	H	H	H	piridin-3-ilo	CH ₃
1.928	CH ₃	H	H	H	piridin-4-ilo	CH ₃
1.929	CH ₃	H	H	H	3-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.930	CH ₃	H	H	H	4-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.931	CH ₃	H	H	H	5-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.932	CH ₃	H	H	H	6-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
1.933	CH ₃	H	H	H	2-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
1.934	CH ₃	H	H	H	4-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
1.935	CH ₃	H	H	H	5-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
1.936	CH ₃	H	H	H	2-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
1.937	CH ₃	H	H	H	3-cloropiridin-4-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.938	CH ₃	H	H	H	2-cloropiridin-5-ilo	CH ₃
1.939	CH ₃	H	H	H	3-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.940	CH ₃	H	H	H	4-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.941	CH ₃	H	H	H	5-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.942	CH ₃	H	H	H	6-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
1.943	CH ₃	H	H	H	2-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
1.944	CH ₃	H	H	H	4-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
1.945	CH ₃	H	H	H	5-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
1.946	CH ₃	H	H	H	2-cianopiridin-5-ilo	CH ₃
1.947	CH ₃	H	H	H	3-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.948	CH ₃	H	H	H	4-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.949	CH ₃	H	H	H	5-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.950	CH ₃	H	H	H	6-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
1.951	CH ₃	H	H	H	2-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
1.952	CH ₃	H	H	H	4-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
1.953	CH ₃	H	H	H	5-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
1.954	CH ₃	H	H	H	2-fluoropiridin-5-ilo	CH ₃
1.955	CH ₃	H	H	H	3-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.956	CH ₃	H	H	H	4-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.957	CH ₃	H	H	H	5-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.958	CH ₃	H	H	H	6-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
1.959	CH ₃	H	H	H	2-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
1.960	CH ₃	H	H	H	4-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
1.961	CH ₃	H	H	H	5-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
1.962	CH ₃	H	H	H	2-nitropiridin-5-ilo	CH ₃
1.963	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.964	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.965	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.966	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
1.967	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
1.968	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
1.969	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
1.970	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	CH ₃
1.971	CH ₃	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)- piridin-3-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.972	CH ₃	H	H	H	2,6-bis(trifluorometil)-piridin-4-ilo	CH ₃
1.973	CH ₃	H	H	H	3,5-bis(trifluorometil)-piridin-2-ilo	CH ₃
1.974	CH ₃	H	H	H	2-tienilo	CH ₃
1.975	CH ₃	H	H	H	3-tienilo	CH ₃
1.976	CH ₃	H	H	H	5-cianotien-2-ilo	CH ₃
1.977	CH ₃	H	H	H	2-furilo	CH ₃
1.978	CH ₃	H	H	H	3-furilo	CH ₃
1.979	CH ₃	H	H	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	CH ₃
1.980	CH ₃	H	H	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	CH ₃
1.981	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-metil-tiopirimidin-4-ilo	CH ₃
1.982	CH ₃	H	H	H	pirazin-2-ilo	CH ₃
1.983	CH ₃	H	H	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	CH ₃
1.984	CH ₃	H	H	H	3-cianopirazin-2-ilo	CH ₃
1.985	CH ₃	H	H	H	quinolin-2-ilo	CH ₃
1.986	CH ₃	H	H	H	3-etilquinolin-2-ilo	CH ₃
1.987	CH ₃	H	H	H	bencilo	CH ₃
1.988	CH ₃	H	H	H	4-fluorobencilo	CH ₃
1.989	CH ₃	H	H	H	4-clorobencilo	CH ₃
1.990	CH ₃	H	H	H	4-metilbencilo	CH ₃
1.991	CH ₃	H	H	H	2,4-dimetilbencilo	CH ₃
1.992	CH ₃	H	H	H	2,4,6-trimetilbencilo	CH ₃
1.993	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ OH
1.994	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₃
1.995	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
1.996	CH ₃	H	H	H	H	CHO
1.997	CH ₃	H	H	H	H	COCH ₃
1.998	CH ₃	H	H	H	H	CO ₂ H
1.999	CH ₃	H	H	H	H	CO ₂ CH ₃
1.1000	CH ₃	H	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃
1.1001	CH ₃	H	H	H	H	CONH ₂
1.1002	CH ₃	H	H	H	H	CONHCH ₃
1.1003	CH ₃	H	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.1004	CH ₃	H	H	H	H	CON(CH ₃) ₂
1.1005	CH ₃	H	H	H	H	CON-(CH ₂ CH ₃) ₂
1.1006	CH ₃	H	H	H	H	CON(CH ₃)O-CH ₃
1.1007	CH ₃	H	H	H	H	CH=NOH
1.1008	CH ₃	H	H	H	H	CH=NOCH ₃
1.1009	CH ₃	H	H	H	H	CH=NOCH ₂ -CH ₃
1.1010	CH ₃	H	H	H	H	C(CH ₃)=NOH
1.1011	CH ₃	H	H	H	H	C(CH ₃)=NO-CH ₃
1.1012	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ OC(O)NH-CH ₃
1.1013	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ NH ₂
1.1014	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ NHCHO
1.1015	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)-CH ₃
1.1016	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃
1.1017	CH ₃	H	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃
1.1018	CH ₃	H	H	H	H	NHCO ₂ -C(CH ₃) ₃
1.1019	CH ₃	H	H	H	H	CH(OH)CH ₃
1.1020	CH ₃	H	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃
1.1021	CH ₃	H	H	H	H	CN
1.1022	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₃
1.1023	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃
1.1024	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃
1.1025	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃
1.1026	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ -CH ₃
1.1027	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ -CH ₃
1.1028	CH ₃	H	H	H	H	OCH ₃
1.1029	CH ₃	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃
1.1030	CH ₃	H	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂
1.1031	CH ₃	H	H	H	H	CH-(OCH ₂ CH ₃) ₂
1.1032	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ CH ₃
1.1033	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.1034	CH ₃	H	H	H	H	CH(CH ₃) ₂
1.1035	CH ₃	H	H	H	H	C(CH ₃) ₃
1.1036	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1.1037	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.1038	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ CN
1.1039	CH ₃	H	H	H	H	ciclopropilo
1.1040	CH ₃	H	H	H	H	ciclobutilo
1.1041	CH ₃	H	H	H	H	ciclopentilo
1.1042	CH ₃	H	H	H	H	ciclohexilo
1.1043	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ -ciclopropilo
1.1044	CH ₃	H	H	H	H	bencilo
1.1045	CH ₃	H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
1.1046	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃
1.1047	H	H	Cl	Cl	H	H
1.1048	H	H	Cl	Cl	H	CH ₃
1.1049	CH ₃	H	Cl	Cl	H	CH ₃
1.1050	H	H	Br	Br	H	H
1.1051	H	H	Br	Br	H	CH ₃
1.1052	CH ₃	H	Br	Br	H	CH ₃
1.1053	H	H	OH	OH	H	H
1.1054	H	H	OH	OH	H	CH ₃
1.1055	CH ₃	H	OH	OH	H	CH ₃
1.1056	H	H	-O-C(CH ₃) ₂ -O-		H	H
1.1057	H	H	-O-C(CH ₃) ₂ -O-		H	CH ₃
1.1058	CH ₃	H	-O-C(CH ₃) ₂ -O-		H	CH ₃
1.1059	H	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =O		H	H	H
1.1060	H	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =O		H	H	CH ₃
1.1061	CH ₃	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =O		H	H	H
1.1062	CH ₃	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =O		H	H	CH ₃
1.1063	H	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₃		H	H	H

ES 2 497 501 T3

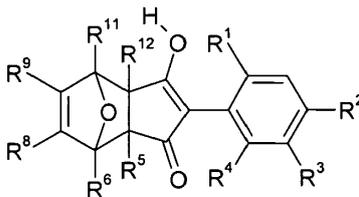
	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
1.1064	H	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₃		H	H	CH ₃
1.1065	CH ₃	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₃		H	H	H
1.1066	CH ₃	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₃		H	H	CH ₃
1.1067	H	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₂ CH ₃		H	H	H
1.1068	H	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₂ CH ₃		H	H	CH ₃
1.1069	CH ₃	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₂ CH ₃		H	H	H
1.1070	CH ₃	R ⁷ y R ⁸ forman la unidad =NOCH ₂ CH ₃		H	H	CH ₃
1.1071	H	H	H	-O-(CH ₂) ₂ -O-		H
1.1072	H	H	H	-O-(CH ₂) ₂ -O-		CH ₃
1.1073	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₂ -O-		H
1.1074	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₂ -O-		CH ₃
1.1075	H	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -O-		H
1.1076	H	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -O-		CH ₃
1.1077	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -O-		H
1.1078	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -O-		CH ₃

La Tabla 71 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es ciclopropilo, R² es metilo, R⁴ es etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 72 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ y R² son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno, R⁴ es ciclopropilo y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 1.

5 La Tabla 73 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ y R² son etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno, R⁴ es ciclopropilo y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 74 cubre compuestos de fórmula (AH)



10

en la que R¹, R² y R⁴ son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

Tabla 74

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.001	H	H	H	H
74.002	H	H	H	CH ₃
74.003	H	H	H	CH ₂ OH
74.004	H	H	H	CH ₂ OCH ₃
74.005	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
74.006	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
74.007	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
74.007	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CO ₂ CH ₃
74.008	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
74.009	H	H	H	CH ₂ OCH ₂ CN
74.010	H	H	H	CH(OH)CH ₃
74.011	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃
74.012	H	H	H	CH(CH ₃)OCH ₂ CH ₃
74.013	H	H	H	CHO
74.014	H	H	H	COCH ₃
74.015	H	H	H	CH ₂ COCH ₃
74.016	H	H	H	CH ₂ CH ₂ COCH ₃
74.017	H	H	H	CO ₂ H
74.018	H	H	H	CO ₂ CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.019	H	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃
74.020	H	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃
74.021	H	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
74.022	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
74.023	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
74.024	H	H	H	CONH ₂
74.025	H	H	H	CONHCH ₃
74.026	H	H	H	CONHCH ₂ CH ₃
74.027	H	H	H	CON(CH ₃) ₂
74.028	H	H	H	CON(CH ₂ CH ₃) ₂
74.029	H	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃
74.030	H	H	H	CH=NOH
74.031	H	H	H	CH=NOCH ₃
74.032	H	H	H	CH=NOCH ₂ CH ₃
74.033	H	H	H	C(CH ₃)=NOH
74.034	H	H	H	C(CH ₃)=NOCH ₃
74.035	H	H	H	CH ₂ OC(O)CH ₃
74.036	H	H	H	CH ₂ OC(O)CH ₂ CH ₃
74.037	H	H	H	CH ₂ OC(O)CH(CH ₃) ₂
74.038	H	H	H	CH ₂ OC(O)C(CH ₃) ₃
74.039	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHCH ₃
74.040	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₃
74.041	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
74.042	H	H	H	CH ₂ OC(O)NHC(CH ₃) ₃
74.043	H	H	H	CH ₂ NH ₂
74.044	H	H	H	CH ₂ NHCHO
74.045	H	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃
74.046	H	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃
74.047	H	H	H	NHCO ₂ CH ₃
74.048	H	H	H	NHCO ₂ C(CH ₃) ₃
74.049	H	H	H	CN
74.050	H	H	H	CH ₂ SCH ₃
74.051	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃
74.052	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.053	H	H	H	CH ₂ SCH(CH ₃) ₂
74.054	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃
74.055	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃
74.056	H	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃
74.057	H	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃
74.058	H	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃
74.059	H	H	H	OCH ₃
74.060	H	H	H	OCH ₂ CH ₃
74.061	H	H	H	CH(OCH ₃) ₂
74.062	H	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂
74.063	H	H	H	1,3-dioxolan-2-ilo
74.064	H	H	H	1,3-dioxan-2-ilo
74.065	H	H	H	5,5-dimetil-1,3-dioxan-2-ilo
74.066	H	H	H	CH ₂ CH ₃
74.067	H	H	H	<i>n</i> -propilo
74.068	H	H	H	isopropilo
74.069	H	H	H	<i>n</i> -butilo
74.070	H	H	H	isobutilo
74.071	H	H	H	<i>sec</i> -butilo
74.072	H	H	H	<i>terc</i> -butilo
74.073	H	H	H	<i>n</i> -pentilo
74.074	H	H	H	neopentilo
74.075	H	H	H	<i>n</i> -hexilo
74.076	H	H	H	<i>n</i> -heptilo
74.077	H	H	H	CH ₂ CN
74.078	H	H	H	ciclopropilo
74.079	H	H	H	ciclobutilo
74.080	H	H	H	ciclopentilo
74.081	H	H	H	ciclohexilo
74.082	H	H	H	CH ₂ -ciclopropilo
74.083	H	H	H	bencilo
74.084	H	H	H	CH ₂ CF ₃
74.085	H	H	H	CH ₂ F
74.086	H	H	H	CHF ₂

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.087	H	H	H	CF ₃
74.088	H	H	CH ₃	H
74.089	H	H	CH ₂ CH ₃	H
74.090	H	H	<i>n</i> -propilo	H
74.091	H	H	isopropilo	H
74.092	H	H	<i>n</i> -butilo	H
74.093	H	H	isobutilo	H
74.094	H	H	<i>sec</i> -butilo	H
74.095	H	H	<i>terc</i> -butilo	H
74.096	H	H	vinilo	H
74.097	H	H	etinilo	H
74.098	H	H	trimetilsilietinilo	H
74.099	H	H	CH ₂ OH	H
74.100	H	H	CH ₂ OCH ₃	H
74.101	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
74.102	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	H
74.103	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
74.104	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
74.105	H	H	CHO	H
74.106	H	H	COCH ₃	H
74.107	H	H	CO ₂ H	H
74.108	H	H	CO ₂ CH ₃	H
74.109	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H
74.110	H	H	CONH ₂	H
74.111	H	H	CONHCH ₃	H
74.112	H	H	CONHCH ₂ CH ₃	H
74.113	H	H	CON(CH ₃) ₂	H
74.114	H	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	H
74.115	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃	H
74.116	H	H	CH=NOH	H
74.117	H	H	CH=N-OCH ₃	H
74.118	H	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	H
74.119	H	H	C(CH ₃)=N-OH	H
74.120	H	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.121	H	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	H
74.122	H	H	CH ₂ NH ₂	H
74.123	H	H	CH ₂ NHCHO	H
74.124	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	H
74.125	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	H
74.126	H	H	CH(OH)CH ₃	H
74.127	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	H
74.128	H	H	CN	H
74.129	H	H	CH ₂ SCH ₃	H
74.130	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃	H
74.131	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
74.132	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H
74.133	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	H
74.134	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	H
74.135	H	H	OCH ₃	H
74.136	H	H	OCH ₂ CH ₃	H
74.137	H	H	CH(OCH ₃) ₂	H
74.138	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	H
74.139	H	H	ciclopropilo	H
74.140	H	H	ciclobutilo	H
74.141	H	H	ciclopentilo	H
74.142	H	H	ciclohexilo	H
74.143	H	H	F	H
74.144	H	H	Cl	H
74.145	H	H	Br	H
74.146	H	H	I	H
74.147	H	H	fenilo	H
74.148	H	H	2-acetilfenilo	H
74.149	H	H	3-acetilfenilo	H
74.150	H	H	4-acetilfenilo	H
74.151	H	H	2-clorofenilo	H
74.152	H	H	3-clorofenilo	H
74.153	H	H	4-clorofenilo	H
74.154	H	H	2-cianofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.155	H	H	3-cianofenilo	H
74.156	H	H	4-cianofenilo	H
74.157	H	H	2-fluorofenilo	H
74.158	H	H	3-fluorofenilo	H
74.159	H	H	4-fluorofenilo	H
74.160	H	H	2-metoxifenilo	H
74.161	H	H	3-metoxifenilo	H
74.162	H	H	4-metoxifenilo	H
74.163	H	H	2-metilfenilo	H
74.164	H	H	3-metilfenilo	H
74.165	H	H	4-metilfenilo	H
74.166	H	H	2-nitrofenilo	H
74.167	H	H	3-nitrofenilo	H
74.168	H	H	4-nitrofenilo	H
74.169	H	H	2-tiometilfenilo	H
74.170	H	H	3-tiometilfenilo	H
74.171	H	H	4-tiometilfenilo	H
74.172	H	H	2-trifluorometoxifenilo	H
74.173	H	H	3-trifluorometoxifenilo	H
74.174	H	H	4-trifluorometoxifenilo	H
74.175	H	H	2-trifluorometilfenilo	H
74.176	H	H	3-trifluorometilfenilo	H
74.177	H	H	4-trifluorometilfenilo	H
74.178	H	H	2,3-diclorofenilo	H
74.179	H	H	2,4-diclorofenilo	H
74.180	H	H	2,5-diclorofenilo	H
74.181	H	H	2,6-diclorofenilo	H
74.182	H	H	3,4-diclorofenilo	H
74.183	H	H	3,5-diclorofenilo	H
74.184	H	H	2,3-difluorofenilo	H
74.185	H	H	2,4-difluorofenilo	H
74.186	H	H	2,5-difluorofenilo	H
74.187	H	H	2,6-difluorofenilo	H
74.188	H	H	3,4-difluorofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.189	H	H	3,5-difluorofenilo	H
74.190	H	H	2,4,6-trifluorofenilo	H
74.191	H	H	2,4-dimetilfenilo	H
74.192	H	H	2,4,6-trimetilfenilo	H
74.193	H	H	3,4,5-trimetoxifenilo	H
74.194	H	H	2-cloro-3-cianofenilo	H
74.195	H	H	2-cloro-4-cianofenilo	H
74.196	H	H	2-cloro-5-cianofenilo	h
74.197	H	H	2-cloro-6-cianofenilo	H
74.198	H	H	3-cloro-2-cianofenilo	H
74.199	H	H	3-cloro-4-cianofenilo	H
74.200	H	H	3-cloro-5-cianofenilo	H
74.201	H	H	5-cloro-2-cianofenilo	H
74.202	H	H	4-cloro-2-cianofenilo	H
74.203	H	H	4-cloro-3-cianofenilo	H
74.204	H	H	2-cloro-3-fluorofenilo	H
74.205	H	H	2-cloro-4-fluorofenilo	H
74.206	H	H	2-cloro-5-fluorofenilo	H
74.207	H	H	2-cloro-6-fluorofenilo	H
74.208	H	H	3-cloro-2-fluorofenilo	H
74.209	H	H	3-cloro-4-fluorofenilo	H
74.210	H	H	3-cloro-5-fluorofenilo	H
74.211	H	H	5-cloro-2-fluorofenilo	H
74.212	H	H	4-cloro-2-fluorofenilo	H
74.213	H	H	4-cloro-3-fluorofenilo	H
74.214	H	H	2-cloro-3-metilfenilo	H
74.215	H	H	2-cloro-4-metilfenilo	H
74.216	H	H	2-cloro-5-metilfenilo	H
74.217	H	H	2-cloro-6-metilfenilo	H
74.218	H	H	3-cloro-2-metilfenilo	H
74.219	H	H	3-cloro-4-metilfenilo	H
74.220	H	H	3-cloro-5-metilfenilo	H
74.221	H	H	5-cloro-2-metilfenilo	H
74.222	H	H	4-cloro-2-metilfenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.223	H	H	4-cloro-3-metilfenilo	H
74.224	H	H	2-ciano-3-fluorofenilo	H
74.225	H	H	2-ciano-4-fluorofenilo	H
74.226	H	H	2-ciano-5-fluorofenilo	H
74.227	H	H	2-ciano-6-fluorofenilo	H
74.228	H	H	3-ciano-2-fluorofenilo	H
74.229	H	H	3-ciano-4-fluorofenilo	H
74.230	H	H	3-ciano-5-fluorofenilo	H
74.231	H	H	5-ciano-2-fluorofenilo	H
74.232	H	H	4-ciano-2-fluorofenilo	H
74.233	H	H	4-ciano-3-fluorofenilo	H
74.234	H	H	2-fluoro-3-metilfenilo	H
74.235	H	H	2-fluoro-4-metilfenilo	H
74.236	H	H	2-fluoro-5-metilfenilo	H
74.237	H	H	2-fluoro-6-metilfenilo	H
74.238	H	H	3-fluoro-2-metilfenilo	H
74.239	H	H	3-fluoro-4-metilfenilo	H
74.240	H	H	3-fluoro-5-metilfenilo	H
74.241	H	H	5-fluoro-2-metilfenilo	H
74.242	H	H	4-fluoro-2-metilfenilo	H
74.243	H	H	4-fluoro-3-metilfenilo	H
74.244	H	H	piridin-2-ilo	H
74.245	H	H	piridin-3-ilo	H
74.246	H	H	piridin-4-ilo	H
74.247	H	H	3-cloropiridin-2-ilo	H
74.248	H	H	4-cloropiridin-2-ilo	H
74.249	H	H	5-cloropiridin-2-ilo	H
74.250	H	H	6-cloropiridin-2-ilo	H
74.251	H	H	2-cloropiridin-3-ilo	H
74.252	H	H	4-cloropiridin-3-ilo	H
74.253	H	H	5-cloropiridin-3-ilo	H
74.254	H	H	2-cloropiridin-4-ilo	H
74.255	H	H	3-cloropiridin-4-ilo	H
74.256	H	H	2-cloropiridin-5-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.257	H	H	3-cianopiridin-2-ilo	H
74.258	H	H	4-cianopiridin-2-ilo	H
74.259	H	H	5-cianopiridin-2-ilo	H
74.260	H	H	6-cianopiridin-2-ilo	H
74.261	H	H	2-cianopiridin-3-ilo	H
74.262	H	H	4-cianopiridin-3-ilo	H
74.263	H	H	5-cianopiridin-3-ilo	H
74.264	H	H	2-cianopiridin-5-ilo	H
74.265	H	H	3-fluoropiridin-2-ilo	H
74.266	H	H	4-fluoropiridin-2-ilo	H
74.267	H	H	5-fluoropiridin-2-ilo	H
74.268	H	H	6-fluoropiridin-2-ilo	H
74.269	H	H	2-fluoropiridin-3-ilo	H
74.270	H	H	4-fluoropiridin-3-ilo	H
74.271	H	H	5-fluoropiridin-3-ilo	H
74.272	H	H	2-fluoropiridin-5-ilo	H
74.273	H	H	3-nitropiridin-2-ilo	H
74.274	H	H	4-nitropiridin-2-ilo	H
74.275	H	H	5-nitropiridin-2-ilo	H
74.276	H	H	6-nitropiridin-2-ilo	H
74.277	H	H	2-nitropiridin-3-ilo	H
74.278	H	H	4-nitropiridin-3-ilo	H
74.279	H	H	5-nitropiridin-3-ilo	H
74.280	H	H	2-nitropiridin-5-ilo	H
74.281	H	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.282	H	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.283	H	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.284	H	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.285	H	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
74.286	H	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
74.287	H	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
74.288	H	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	H
74.289	H	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-3-ilo	H
74.290	H	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.291	H	H	3,5-bis(trifluorometil)piridin-2-ilo	H
74.292	H	H	2-tienilo	H
74.293	H	H	3-tienilo	H
74.294	H	H	5-cianotien-2-ilo	H
74.295	H	H	2-furilo	H
74.296	H	H	3-furilo	H
74.297	H	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	H
74.298	H	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	H
74.299	H	H	5-metil-2-metiltiopirimidin-4-ilo	H
74.300	H	H	pirazin-2-ilo	H
74.301	H	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	H
74.302	H	H	3-cianopirazin-2-ilo	H
74.303	H	H	quinolin-2-ilo	H
74.304	H	H	3-etilquinolin-2-ilo	H
74.305	H	H	bencilo	H
74.306	H	H	4-fluorobencilo	H
74.307	H	H	4-clorobencilo	H
74.308	H	H	4-metilbencilo	H
74.309	H	H	2,4-dimetilbencilo	H
74.310	H	H	2,4,6-trimetilbencilo	H
74.311	H	H	CH ₃	CH ₃
74.312	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.313	H	H	<i>n</i> -propilo	CH ₃
74.314	H	H	isopropilo	CH ₃
74.315	H	H	<i>n</i> -butilo	CH ₃
74.316	H	H	isobutilo	CH ₃
74.317	H	H	<i>sec</i> -butilo	CH ₃
74.318	H	H	<i>terc</i> -butilo	CH ₃
74.319	H	H	vinilo	CH ₃
74.320	H	H	etinilo	CH ₃
74.321	H	H	trimetilsilietinilo	CH ₃
74.322	H	H	CH ₂ OH	CH ₃
74.323	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
74.324	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.325	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	CH ₃
74.326	H	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.327	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
74.328	H	H	CHO	CH ₃
74.329	H	H	COCH ₃	CH ₃
74.330	H	H	CO ₂ H	CH ₃
74.331	H	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃
74.332	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.333	H	H	CONH ₂	CH ₃
74.334	H	H	CONHCH ₃	CH ₃
74.335	H	H	CONHCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.336	H	H	CON(CH ₃) ₂	CH ₃
74.337	H	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	CH ₃
74.338	H	H	CON(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
74.339	H	H	CH=NOH	CH ₃
74.340	H	H	CH=N-OCH ₃	CH ₃
74.341	H	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.342	H	H	C(CH ₃)=N-OH	CH ₃
74.343	H	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃
74.344	H	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	CH ₃
74.345	H	H	CH ₂ NH ₂	CH ₃
74.346	H	H	CH ₂ NHCHO	CH ₃
74.347	H	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	CH ₃
74.348	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃
74.349	H	H	CH(OH)CH ₃	CH ₃
74.350	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
74.351	H	H	CN	CH ₃
74.352	H	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃
74.353	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃
74.354	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃
74.355	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.356	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.357	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.358	H	H	OCH ₃	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.359	H	H	OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.360	H	H	CH(OCH ₃) ₂	CH ₃
74.361	H	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃
74.362	H	H	ciclopropilo	CH ₃
74.363	H	H	ciclobutilo	CH ₃
74.364	H	H	ciclopentilo	CH ₃
74.365	H	H	ciclohexilo	CH ₃
74.366	H	H	F	CH ₃
74.367	H	H	Cl	CH ₃
74.368	H	H	Br	CH ₃
74.369	H	H	I	CH ₃
74.370	H	H	fenilo	CH ₃
74.371	H	H	2-acetilfenilo	CH ₃
74.372	H	H	3-acetilfenilo	CH ₃
74.373	H	H	4-acetilfenilo	CH ₃
74.374	H	H	2-clorofenilo	CH ₃
74.375	H	H	3-clorofenilo	CH ₃
74.376	H	H	4-clorofenilo	CH ₃
74.377	H	H	2-cianofenilo	CH ₃
74.378	H	H	3-cianofenilo	CH ₃
74.379	H	H	4-cianofenilo	CH ₃
74.380	H	H	2-fluorofenilo	CH ₃
74.381	H	H	3-fluorofenilo	CH ₃
74.382	H	H	4-fluorofenilo	CH ₃
74.383	H	H	2-metoxifenilo	CH ₃
74.384	H	H	3-metoxifenilo	CH ₃
74.385	H	H	4-metoxifenilo	CH ₃
74.386	H	H	2-metilfenilo	CH ₃
74.387	H	H	3-metilfenilo	CH ₃
74.388	H	H	4-metilfenilo	CH ₃
74.389	H	H	2-nitrofenilo	CH ₃
74.390	H	H	3-nitrofenilo	CH ₃
74.391	H	H	4-nitrofenilo	CH ₃
74.392	H	H	2-tiometilfenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.393	H	H	3-tiometilfenilo	CH ₃
74.394	H	H	4-tiometilfenilo	CH ₃
74.395	H	H	2-trifluorometoxifenilo	CH ₃
74.396	H	H	3-trifluorometoxifenilo	CH ₃
74.397	H	H	4-trifluorometoxifenilo	CH ₃
74.398	H	H	2-trifluorometilfenilo	CH ₃
74.399	H	H	3-trifluorometilfenilo	CH ₃
74.400	H	H	4-trifluorometilfenilo	CH ₃
74.401	H	H	2,3-diclorofenilo	CH ₃
74.402	H	H	2,4-diclorofenilo	CH ₃
74.403	H	H	2,5-diclorofenilo	CH ₃
74.404	H	H	2,6-diclorofenilo	CH ₃
74.405	H	H	3,4-diclorofenilo	CH ₃
74.406	H	H	3,5-diclorofenilo	CH ₃
74.407	H	H	2,3-difluorofenilo	CH ₃
74.408	H	H	2,4-difluorofenilo	CH ₃
74.409	H	H	2,5-difluorofenilo	CH ₃
74.410	H	H	2,6-difluorofenilo	CH ₃
74.411	H	H	3,4-difluorofenilo	CH ₃
74.412	H	H	3,5-difluorofenilo	CH ₃
74.413	H	H	2,4,6-trifluorofenilo	CH ₃
74.414	H	H	2,4-dimetilfenilo	CH ₃
74.415	H	H	2,4,6-trimetilfenilo	CH ₃
74.416	H	H	3,4,5-trimetoxifenilo	CH ₃
74.417	H	H	2-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
74.418	H	H	2-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
74.419	H	H	2-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
74.420	H	H	2-cloro-6-cianofenilo	CH ₃
74.421	H	H	3-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
74.422	H	H	3-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
74.423	H	H	3-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
74.424	H	H	5-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
74.425	H	H	4-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
74.426	H	H	4-cloro-3-ciano-fenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.427	H	H	2-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
74.428	H	H	2-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
74.429	H	H	2-cloro-5-fluoro-fenilo	CH ₃
74.430	H	H	2-cloro-6-fluorofenilo	CH ₃
74.431	H	H	3-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
74.432	H	H	3-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
74.433	H	H	3-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
74.434	H	H	5-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
74.435	H	H	4-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
74.436	H	H	4-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
74.437	H	H	2-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
74.438	H	H	2-cloro-4-metil fenilo	CH ₃
74.439	H	H	2-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
74.440	H	H	2-cloro-6-metilfenilo	CH ₃
74.441	H	H	3-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
74.442	H	H	3-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
74.443	H	H	3-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
74.444	H	H	5-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
74.445	H	H	4-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
74.446	H	H	4-cloro-3-metil fenilo	CH ₃
74.447	H	H	2-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
74.448	H	H	2-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
74.449	H	H	2-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
74.450	H	H	2-ciano-6-fluorofenilo	CH ₃
74.451	H	H	3-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
74.452	H	H	3-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
74.453	H	H	3-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
74.454	H	H	5-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
74.455	H	H	4-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
74.456	H	H	4-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
74.457	H	H	2-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
74.458	H	H	2-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
74.459	H	H	2-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
74.460	H	H	2-fluoro-6-metilfenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.461	H	H	3-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
74.462	H	H	3-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
74.463	H	H	3-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
74.464	H	H	5-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
74.465	H	H	4-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
74.466	H	H	4-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
74.467	H	H	piridin-2-ilo	CH ₃
74.468	H	H	piridin-3-ilo	CH ₃
74.469	H	H	piridin-4-ilo	CH ₃
74.470	H	H	3-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.471	H	H	4-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.472	H	H	5-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.473	H	H	6-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.474	H	H	2-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
74.475	H	H	4-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
74.476	H	H	5-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
74.477	H	H	2-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
74.478	H	H	3-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
74.479	H	H	2-cloropiridin-5-ilo	CH ₃
74.480	H	H	3-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.481	H	H	4-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.482	H	H	5-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.483	H	H	6-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.484	H	H	2-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
74.485	H	H	4-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
74.486	H	H	5-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
74.487	H	H	2-cianopiridin-5-ilo	CH ₃
74.488	H	H	3-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.489	H	H	4-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.490	H	H	5-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.491	H	H	6-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.492	H	H	2-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
74.493	H	H	4-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
74.494	H	H	5-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.495	H	H	2-fluoropiridin-5-ilo	CH ₃
74.496	H	H	3-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.497	H	H	4-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.498	H	H	5-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.499	H	H	6-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.500	H	H	2-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
74.501	H	H	4-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
74.502	H	H	5-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
74.503	H	H	2-nitropiridin-5-ilo	CH ₃
74.504	H	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.505	H	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.506	H	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.507	H	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.508	H	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
74.509	H	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
74.510	H	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
74.511	H	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	CH ₃
74.512	H	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-3-ilo	CH ₃
74.513	H	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-ilo	CH ₃
74.514	H	H	3,5-bis(trifluorometil)piridin-2-ilo	CH ₃
74.515	H	H	2-tienilo	CH ₃
74.516	H	H	3-tienilo	CH ₃
74.517	H	H	5-cianotien-2-ilo	CH ₃
74.518	H	H	2-furilo	CH ₃
74.519	H	H	3-furilo	CH ₃
74.520	H	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	CH ₃
74.521	H	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	CH ₃
74.522	H	H	5-metil-2-metiltiopirimidin-4-ilo	CH ₃
74.523	H	H	pirazin-2-ilo	CH ₃
74.524	H	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	CH ₃
74.525	H	H	3-cianopirazin-2-ilo	CH ₃
74.526	H	H	quinolin-2-ilo	CH ₃
74.527	H	H	3-etilquinolin-2-ilo	CH ₃
74.528	H	H	bencilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.529	H	H	4-fluorobencilo	CH ₃
74.530	H	H	4-clorobencilo	CH ₃
74.531	H	H	4-metilbencilo	CH ₃
74.532	H	H	2,4-dimetilbencilo	CH ₃
74.533	H	H	2,4,6-trimetilbencilo	CH ₃
74.534	CH ₃	H	CH ₃	H
74.535	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	H
74.536	CH ₃	H	<i>n</i> -propilo	H
74.537	CH ₃	H	isopropilo	H
74.538	CH ₃	H	<i>n</i> -butilo	H
74.539	CH ₃	H	isobutilo	H
74.540	CH ₃	H	<i>sec</i> -butilo	H
74.541	CH ₃	H	<i>terc</i> -butilo	H
74.542	CH ₃	H	vinilo	H
74.543	CH ₃	H	etinilo	H
74.544	CH ₃	H	trimetilsililetinilo	H
74.545	CH ₃	H	CH ₂ OH	H
74.546	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	H
74.547	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
74.548	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	H
74.549	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H
74.550	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
74.551	CH ₃	H	CHO	H
74.552	CH ₃	H	COCH ₃	H
74.553	CH ₃	H	CO ₂ H	H
74.554	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H
74.555	CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H
74.556	CH ₃	H	CONH ₂	H
74.557	CH ₃	H	CONHCH ₃	H
74.558	CH ₃	H	CONHCH ₂ CH ₃	H
74.559	CH ₃	H	CON(CH ₃) ₂	H
74.560	CH ₃	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	H
74.561	CH ₃	H	CON(CH ₃)OCH ₃	H
74.562	CH ₃	H	CH=NOH	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.563	CH ₃	H	CH=N-OCH ₃	H
74.564	CH ₃	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	H
74.565	CH ₃	H	C(CH ₃)=N-OH	H
74.566	CH ₃	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H
74.567	CH ₃	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	H
74.568	CH ₃	H	CH ₂ NH ₂	H
74.569	CH ₃	H	CH ₂ NHCHO	H
74.570	CH ₃	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	H
74.571	CH ₃	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	H
74.572	CH ₃	H	CH(OH)CH ₃	H
74.573	CH ₃	H	CH(CH ₃)OCH ₃	H
74.574	CH ₃	H	CN	H
74.575	CH ₃	H	CH ₂ SCH ₃	H
74.576	CH ₃	H	CH ₂ S(O)CH ₃	H
74.577	CH ₃	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
74.578	CH ₃	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H
74.579	CH ₃	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	H
74.580	CH ₃	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	H
74.581	CH ₃	H	OCH ₃	H
74.582	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	H
74.583	CH ₃	H	CH(OCH ₃) ₂	H
74.584	CH ₃	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	H
74.585	CH ₃	H	ciclopropilo	H
74.586	CH ₃	H	ciclobutilo	H
74.587	CH ₃	H	ciclopentilo	H
74.588	CH ₃	H	ciclohexilo	H
74.589	CH ₃	H	F	H
74.590	CH ₃	H	Cl	H
74.591	CH ₃	H	Br	H
74.592	CH ₃	H	I	H
74.593	CH ₃	H	fenilo	H
74.594	CH ₃	H	2-acetilfenilo	H
74.595	CH ₃	H	3-acetilfenilo	H
74.596	CH ₃	H	4-acetilfenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.597	CH ₃	H	2-clorofenilo	H
74.598	CH ₃	H	3-clorofenilo	H
74.599	CH ₃	H	4-clorofenilo	H
74.600	CH ₃	H	2-cianofenilo	H
74.601	CH ₃	H	3-cianofenilo	H
74.602	CH ₃	H	4-cianofenilo	H
74.603	CH ₃	H	2-fluorofenilo	H
74.604	CH ₃	H	3-fluorofenilo	H
74.605	CH ₃	H	4-fluorofenilo	H
74.606	CH ₃	H	2-metoxifenilo	H
74.607	CH ₃	H	3-metoxifenilo	H
74.608	CH ₃	H	4-metoxifenilo	H
74.609	CH ₃	H	2-metilfenilo	H
74.610	CH ₃	H	3-metilfenilo	H
74.611	CH ₃	H	4-metilfenilo	H
74.612	CH ₃	H	2-nitrofenilo	H
74.613	CH ₃	H	3-nitrofenilo	H
74.614	CH ₃	H	4-nitrofenilo	H
74.615	CH ₃	H	2-tiometilfenilo	H
74.616	CH ₃	H	3-tiometilfenilo	H
74.617	CH ₃	H	4-tiometilfenilo	H
74.618	CH ₃	H	2-trifluorometoxifenilo	H
74.619	CH ₃	H	3-trifluorometoxifenilo	H
74.620	CH ₃	H	4-trifluorometoxifenilo	H
74.621	CH ₃	H	2-trifluorometilfenilo	H
74.622	CH ₃	H	3-trifluorometilfenilo	H
74.623	CH ₃	H	4-trifluorometilfenilo	H
74.624	CH ₃	H	2,3-diclorofenilo	H
74.625	CH ₃	H	2,4-diclorofenilo	H
74.626	CH ₃	H	2,5-diclorofenilo	H
74.627	CH ₃	H	2,6-diclorofenilo	H
74.628	CH ₃	H	3,4-diclorofenilo	H
74.629	CH ₃	H	3,5-diclorofenilo	H
74.630	CH ₃	H	2,3-difluorofenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.631	CH ₃	H	2,4-difluorofenilo	H
74.632	CH ₃	H	2,5-difluorofenilo	H
74.633	CH ₃	H	2,6-difluorofenilo	H
74.634	CH ₃	H	3,4-difluorofenilo	H
74.635	CH ₃	H	3,5-difluorofenilo	H
74.636	CH ₃	H	2,4,6-trifluorofenilo	H
74.637	CH ₃	H	2,4-dimetilfenilo	H
74.638	CH ₃	H	2,4,6-trimetilfenilo	H
74.639	CH ₃	H	3,4,5-trimetoxifenilo	H
74.640	CH ₃	H	2-cloro-3-cianofenilo	H
74.641	CH ₃	H	2-cloro-4-cianofenilo	H
74.642	CH ₃	H	2-cloro-5-cianofenilo	H
74.643	CH ₃	H	2-cloro-6-cianofenilo	H
74.644	CH ₃	H	3-cloro-2-cianofenilo	H
74.645	CH ₃	H	3-cloro-4-cianofenilo	H
74.646	CH ₃	H	3-cloro-5-cianofenilo	H
74.647	CH ₃	H	5-cloro-2-cianofenilo	H
74.648	CH ₃	H	4-cloro-2-cianofenilo	H
74.649	CH ₃	H	4-cloro-3-cianofenilo	H
74.650	CH ₃	H	2-cloro-3-fluorofenilo	H
74.651	CH ₃	H	2-cloro-4-fluorofenilo	H
74.652	CH ₃	H	2-cloro-5-fluorofenilo	H
74.653	CH ₃	H	2-cloro-6-fluorofenilo	H
74.654	CH ₃	H	3-cloro-2-fluorofenilo	H
74.655	CH ₃	H	3-cloro-4-fluorofenilo	H
74.656	CH ₃	H	3-cloro-5-fluorofenilo	H
74.657	CH ₃	H	5-cloro-2-fluorofenilo	H
74.658	CH ₃	H	4-cloro-2-fluorofenilo	H
74.659	CH ₃	H	4-cloro-3-fluorofenilo	H
74.660	CH ₃	H	2-cloro-3-metilfenilo	H
74.661	CH ₃	H	2-cloro-4-metilfenilo	H
74.662	CH ₃	H	2-cloro-5-metilfenilo	H
74.663	CH ₃	H	2-cloro-6-metilfenilo	H
74.664	CH ₃	H	3-cloro-2-metilfenilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.665	CH ₃	H	3-cloro-4-metilfenilo	H
74.666	CH ₃	H	3-cloro-5-metilfenilo	H
74.667	CH ₃	H	5-cloro-2-metilfenilo	H
74.668	CH ₃	H	4-cloro-2-metilfenilo	H
74.669	CH ₃	H	4-cloro-3-metilfenilo	H
74.670	CH ₃	H	2-ciano-3-fluorofenilo	H
74.671	CH ₃	H	2-ciano-4-fluorofenilo	H
74.672	CH ₃	H	2-ciano-5-fluorofenilo	H
74.673	CH ₃	H	2-ciano-6-fluorofenilo	H
74.674	CH ₃	H	3-ciano-2-fluorofenilo	H
74.675	CH ₃	H	3-ciano-4-fluorofenilo	H
74.676	CH ₃	H	3-ciano-5-fluorofenilo	H
74.677	CH ₃	H	5-ciano-2-fluorofenilo	H
74.678	CH ₃	H	4-ciano-2-fluorofenilo	H
74.679	CH ₃	H	4-ciano-3-fluorofenilo	H
74.680	CH ₃	H	2-fluoro-3-metilfenilo	H
74.681	CH ₃	H	2-fluoro-4-metilfenilo	H
74.682	CH ₃	H	2-fluoro-5-metilfenilo	H
74.683	CH ₃	H	2-fluoro-6-metilfenilo	H
74.684	CH ₃	H	3-fluoro-2-metilfenilo	H
74.685	CH ₃	H	3-fluoro-4-metilfenilo	H
74.686	CH ₃	H	3-fluoro-5-metilfenilo	H
74.687	CH ₃	H	5-fluoro-2-metilfenilo	H
74.688	CH ₃	H	4-fluoro-2-metilfenilo	H
74.689	CH ₃	H	4-fluoro-3-metilfenilo	H
74.690	CH ₃	H	piridin-2-ilo	H
74.691	CH ₃	H	piridin-3-ilo	H
74.692	CH ₃	H	piridin-4-ilo	H
74.693	CH ₃	H	3-cloropiridin-2-ilo	H
74.694	CH ₃	H	4-cloropiridin-2-ilo	H
74.695	CH ₃	H	5-cloropiridin-2-ilo	H
74.696	CH ₃	H	6-cloropiridin-2-ilo	H
74.697	CH ₃	H	2-cloropiridin-3-ilo	H
74.698	CH ₃	H	4-cloropiridin-3-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.699	CH ₃	H	5-cloropiridin-3-ilo	H
74.700	CH ₃	H	2-cloropiridin-4-ilo	H
74.701	CH ₃	H	3-cloropiridin-4-ilo	H
74.702	CH ₃	H	2-cloropiridin-5-ilo	H
74.703	CH ₃	H	3-cianopiridin-2-ilo	H
74.704	CH ₃	H	4-cianopiridin-2-ilo	H
74.705	CH ₃	H	5-cianopiridin-2-ilo	H
74.706	CH ₃	H	6-cianopiridin-2-ilo	H
74.707	CH ₃	H	2-cianopiridin-3-ilo	H
74.708	CH ₃	H	4-cianopiridin-3-ilo	H
74.709	CH ₃	H	5-cianopiridin-3-ilo	H
74.710	CH ₃	H	2-cianopiridin-5-ilo	H
74.711	CH ₃	H	3-fluoropiridin-2-ilo	H
74.712	CH ₃	H	4-fluoropiridin-2-ilo	H
74.713	CH ₃	H	5-fluoropiridin-2-ilo	H
74.714	CH ₃	H	6-fluoropiridin-2-ilo	H
74.715	CH ₃	H	2-fluoropiridin-3-ilo	H
74.716	CH ₃	H	4-fluoropiridin-3-ilo	H
74.717	CH ₃	H	5-fluoropiridin-3-ilo	H
74.718	CH ₃	H	2-fluoropiridin-5-ilo	H
74.719	CH ₃	H	3-nitropiridin-2-ilo	H
74.720	CH ₃	H	4-nitropiridin-2-ilo	H
74.721	CH ₃	H	5-nitropiridin-2-ilo	H
74.722	CH ₃	H	6-nitropiridin-2-ilo	H
74.723	CH ₃	H	2-nitropiridin-3-ilo	H
74.724	CH ₃	H	4-nitropiridin-3-ilo	H
74.725	CH ₃	H	5-nitropiridin-3-ilo	H
74.726	CH ₃	H	2-nitropiridin-5-ilo	H
74.727	CH ₃	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.728	CH ₃	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.729	CH ₃	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.730	CH ₃	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	H
74.731	CH ₃	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
74.732	CH ₃	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	H

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.733	CH ₃	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	H
74.734	CH ₃	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	H
74.735	CH ₃	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-3-ilo	H
74.736	CH ₃	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-ilo	H
74.737	CH ₃	H	3,5-bis(trifluorometil)piridin-2-ilo	H
74.738	CH ₃	H	2-tienilo	H
74.739	CH ₃	H	3-tienilo	H
74.740	CH ₃	H	5-cianotien-2-ilo	H
74.741	CH ₃	H	2-furilo	H
74.742	CH ₃	H	3-furilo	H
74.743	CH ₃	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	H
74.744	CH ₃	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	H
74.745	CH ₃	H	5-metil-2-metiltiopirimidin-4-ilo	H
74.746	CH ₃	H	pirazin-2-ilo	H
74.747	CH ₃	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	H
74.748	CH ₃	H	3-cianopirazin-2-ilo	H
74.749	CH ₃	H	quinolin-2-ilo	H
74.750	CH ₃	H	3-etilquinolin-2-ilo	H
74.751	CH ₃	H	bencilo	H
74.752	CH ₃	H	4-fluorobencilo	H
74.753	CH ₃	H	4-clorobencilo	H
74.754	CH ₃	H	4-metilbencilo	H
74.755	CH ₃	H	2,4-dimetilbencilo	H
74.756	CH ₃	H	2,4,6-trimetilbencilo	H
74.757	CH ₃	H	H	CH ₃
74.758	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
74.759	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.760	CH ₃	H	n-propilo	CH ₃
74.761	CH ₃	H	isopropilo	CH ₃
74.762	CH ₃	H	n-butilo	CH ₃
74.763	CH ₃	H	isobutilo	CH ₃
74.764	CH ₃	H	sec-butilo	CH ₃
74.765	CH ₃	H	terc-butilo	CH ₃
74.766	CH ₃	H	vinilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.767	CH ₃	H	etinilo	CH ₃
74.768	CH ₃	H	trimetilsililetinilo	CH ₃
74.769	CH ₃	H	CH ₂ OH	CH ₃
74.770	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
74.771	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.772	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	CH ₃
74.773	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.774	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
74.775	CH ₃	H	CHO	CH ₃
74.776	CH ₃	H	COCH ₃	CH ₃
74.777	CH ₃	H	CO ₂ H	CH ₃
74.778	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃
74.779	CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.780	CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃
74.781	CH ₃	H	CONHCH ₃	CH ₃
74.782	CH ₃	H	CONHCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.783	CH ₃	H	CON(CH ₃) ₂	CH ₃
74.784	CH ₃	H	CON(CH ₂ -CH ₃) ₂	CH ₃
74.785	CH ₃	H	CON(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
74.786	CH ₃	H	CH=NOH	CH ₃
74.787	CH ₃	H	CH=N-OCH ₃	CH ₃
74.788	CH ₃	H	CH=N-OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.789	CH ₃	H	C(CH ₃)=N-OH	CH ₃
74.790	CH ₃	H	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃
74.791	CH ₃	H	CH ₂ OC(O)-NHCH ₃	CH ₃
74.792	CH ₃	H	CH ₂ NH ₂	CH ₃
74.793	CH ₃	H	CH ₂ NHCHO	CH ₃
74.794	CH ₃	H	CH ₂ NHC(O)CH ₃	CH ₃
74.795	CH ₃	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃
74.796	CH ₃	H	CH(OH)CH ₃	CH ₃
74.797	CH ₃	H	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
74.798	CH ₃	H	CN	CH ₃
74.799	CH ₃	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃
74.800	CH ₃	H	CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.801	CH ₃	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃
74.802	CH ₃	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.803	CH ₃	H	CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.804	CH ₃	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
74.805	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₃
74.806	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	CH ₃
74.807	CH ₃	H	CH(OCH ₃) ₂	CH ₃
74.808	CH ₃	H	CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃
74.809	CH ₃	H	ciclopropilo	CH ₃
74.810	CH ₃	H	ciclobutilo	CH ₃
74.811	CH ₃	H	ciclopentilo	CH ₃
74.812	CH ₃	H	ciclohexilo	CH ₃
74.813	CH ₃	H	F	CH ₃
74.814	CH ₃	H	Cl	CH ₃
74.815	CH ₃	H	Br	CH ₃
74.816	CH ₃	H	I	CH ₃
74.817	CH ₃	H	fenilo	CH ₃
74.818	CH ₃	H	2-acetilfenilo	CH ₃
74.819	CH ₃	H	3-acetilfenilo	CH ₃
74.820	CH ₃	H	4-acetilfenilo	CH ₃
74.821	CH ₃	H	2-clorofenilo	CH ₃
74.822	CH ₃	H	3-clorofenilo	CH ₃
74.823	CH ₃	H	4-clorofenilo	CH ₃
74.824	CH ₃	H	2-cianofenilo	CH ₃
74.825	CH ₃	H	3-cianofenilo	CH ₃
74.826	CH ₃	H	4-cianofenilo	CH ₃
74.827	CH ₃	H	2-fluorofenilo	CH ₃
74.828	CH ₃	H	3-fluorofenilo	CH ₃
74.829	CH ₃	H	4-fluorofenilo	CH ₃
74.830	CH ₃	H	2-metoxifenilo	CH ₃
74.831	CH ₃	H	3-metoxifenilo	CH ₃
74.832	CH ₃	H	4-metoxifenilo	CH ₃
74.833	CH ₃	H	2-metilfenilo	CH ₃
74.834	CH ₃	H	3-metilfenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.835	CH ₃	H	4-metilfenilo	CH ₃
74.836	CH ₃	H	2-nitrofenilo	CH ₃
74.837	CH ₃	H	3-nitrofenilo	CH ₃
74.838	CH ₃	H	4-nitrofenilo	CH ₃
74.839	CH ₃	H	2-tiometilfenilo	CH ₃
74.840	CH ₃	H	3-tiometilfenilo	CH ₃
74.841	CH ₃	H	4-tiometilfenilo	CH ₃
74.842	CH ₃	H	2-trifluorometoxifenilo	CH ₃
74.843	CH ₃	H	3-trifluorometoxifenilo	CH ₃
74.844	CH ₃	H	4-trifluorometoxifenilo	CH ₃
74.845	CH ₃	H	2-trifluorometilfenilo	CH ₃
74.846	CH ₃	H	3-trifluorometilfenilo	CH ₃
74.847	CH ₃	H	4-trifluorometilfenilo	CH ₃
74.848	CH ₃	H	2,3-diclorofenilo	CH ₃
74.849	CH ₃	H	2,4-diclorofenilo	CH ₃
74.850	CH ₃	H	2,5-diclorofenilo	CH ₃
74.851	CH ₃	H	2,6-diclorofenilo	CH ₃
74.852	CH ₃	H	3,4-diclorofenilo	CH ₃
74.853	CH ₃	H	3,5-diclorofenilo	CH ₃
74.854	CH ₃	H	2,3-difluorofenilo	CH ₃
74.855	CH ₃	H	2,4-difluorofenilo	CH ₃
74.856	CH ₃	H	2,5-difluorofenilo	CH ₃
74.857	CH ₃	H	2,6-difluorofenilo	CH ₃
74.858	CH ₃	H	3,4-difluorofenilo	CH ₃
74.859	CH ₃	H	3,5-difluorofenilo	CH ₃
74.860	CH ₃	H	2,4,6-trifluorofenilo	CH ₃
74.861	CH ₃	H	2,4-dimetilfenilo	CH ₃
74.862	CH ₃	H	2,4,6-trimetilfenilo	CH ₃
74.863	CH ₃	H	3,4,5-trimetoxifenilo	CH ₃
74.864	CH ₃	H	2-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
74.865	CH ₃	H	2-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
74.866	CH ₃	H	2-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
74.867	CH ₃	H	2-cloro-6-cianofenilo	CH ₃
74.868	CH ₃	H	3-cloro-2-cianofenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.869	CH ₃	H	3-cloro-4-cianofenilo	CH ₃
74.870	CH ₃	H	3-cloro-5-cianofenilo	CH ₃
74.871	CH ₃	H	5-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
74.872	CH ₃	H	4-cloro-2-cianofenilo	CH ₃
74.873	CH ₃	H	4-cloro-3-cianofenilo	CH ₃
74.874	CH ₃	H	2-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
74.875	CH ₃	H	2-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
74.876	CH ₃	H	2-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
74.877	CH ₃	H	2-cloro-6-fluorofenilo	CH ₃
74.878	CH ₃	H	3-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
74.879	CH ₃	H	3-cloro-4-fluorofenilo	CH ₃
74.880	CH ₃	H	3-cloro-5-fluorofenilo	CH ₃
74.881	CH ₃	H	5-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
74.882	CH ₃	H	4-cloro-2-fluorofenilo	CH ₃
74.883	CH ₃	H	4-cloro-3-fluorofenilo	CH ₃
74.884	CH ₃	H	2-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
74.885	CH ₃	H	2-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
74.886	CH ₃	H	2-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
74.887	CH ₃	H	2-cloro-6-metilfenilo	CH ₃
74.888	CH ₃	H	3-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
74.889	CH ₃	H	3-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
74.890	CH ₃	H	3-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
74.891	CH ₃	H	5-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
74.892	CH ₃	H	4-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
74.893	CH ₃	H	4-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
74.894	CH ₃	H	2-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
74.895	CH ₃	H	2-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
74.896	CH ₃	H	2-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
74.897	CH ₃	H	2-ciano-6-fluorofenilo	CH ₃
74.898	CH ₃	H	3-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
74.899	CH ₃	H	3-ciano-4-fluorofenilo	CH ₃
74.901	CH ₃	H	3-ciano-5-fluorofenilo	CH ₃
74.902	CH ₃	H	5-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃
74.903	CH ₃	H	4-ciano-2-fluorofenilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.904	CH ₃	H	4-ciano-3-fluorofenilo	CH ₃
74.905	CH ₃	H	2-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
74.906	CH ₃	H	2-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
74.907	CH ₃	H	2-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
74.908	CH ₃	H	2-fluoro-6-metilfenilo	CH ₃
74.909	CH ₃	H	3-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
74.910	CH ₃	H	3-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
74.911	CH ₃	H	3-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
74.912	CH ₃	H	5-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
74.913	CH ₃	H	4-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
74.914	CH ₃	H	4-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
74.915	CH ₃	H	piridin-2-ilo	CH ₃
74.916	CH ₃	H	piridin-3-ilo	CH ₃
74.917	CH ₃	H	piridin-4-ilo	CH ₃
74.918	CH ₃	H	3-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.919	CH ₃	H	4-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.920	CH ₃	H	5-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.921	CH ₃	H	6-cloropiridin-2-ilo	CH ₃
74.922	CH ₃	H	2-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
74.923	CH ₃	H	4-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
74.924	CH ₃	H	5-cloropiridin-3-ilo	CH ₃
74.925	CH ₃	H	2-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
74.926	CH ₃	H	3-cloropiridin-4-ilo	CH ₃
74.927	CH ₃	H	2-cloropiridin-5-ilo	CH ₃
74.928	CH ₃	H	3-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.929	CH ₃	H	4-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.930	CH ₃	H	5-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.931	CH ₃	H	6-cianopiridin-2-ilo	CH ₃
74.932	CH ₃	H	2-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
74.933	CH ₃	H	4-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
74.934	CH ₃	H	5-cianopiridin-3-ilo	CH ₃
74.935	CH ₃	H	2-cianopiridin-5-ilo	CH ₃
74.936	CH ₃	H	3-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.937	CH ₃	H	4-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.938	CH ₃	H	5-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.939	CH ₃	H	6-fluoropiridin-2-ilo	CH ₃
74.940	CH ₃	H	2-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
74.941	CH ₃	H	4-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
74.942	CH ₃	H	5-fluoropiridin-3-ilo	CH ₃
74.943	CH ₃	H	2-fluoropiridin-5-ilo	CH ₃
74.944	CH ₃	H	3-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.945	CH ₃	H	4-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.946	CH ₃	H	5-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.947	CH ₃	H	6-nitropiridin-2-ilo	CH ₃
74.948	CH ₃	H	2-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
74.949	CH ₃	H	4-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
74.950	CH ₃	H	5-nitropiridin-3-ilo	CH ₃
74.951	CH ₃	H	2-nitropiridin-5-ilo	CH ₃
74.952	CH ₃	H	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.953	CH ₃	H	4-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.954	CH ₃	H	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.955	CH ₃	H	6-trifluorometilpiridin-2-ilo	CH ₃
74.956	CH ₃	H	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
74.957	CH ₃	H	4-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
74.958	CH ₃	H	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	CH ₃
74.959	CH ₃	H	2-trifluorometilpiridin-5-ilo	CH ₃
74.960	CH ₃	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-3-ilo	CH ₃
74.961	CH ₃	H	2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-ilo	CH ₃
74.962	CH ₃	H	3,5-bis(trifluorometil)piridin-2-ilo	CH ₃
74.963	CH ₃	H	2-tienilo	CH ₃
74.964	CH ₃	H	3-tienilo	CH ₃
74.965	CH ₃	H	5-cianotien-2-ilo	CH ₃
74.966	CH ₃	H	2-furilo	CH ₃
74.967	CH ₃	H	3-furilo	CH ₃
74.968	CH ₃	H	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo	CH ₃
74.969	CH ₃	H	2-metiltiopirimidin-4-ilo	CH ₃
74.970	CH ₃	H	5-metil-2-metiltiopirimidin-4-ilo	CH ₃
74.971	CH ₃	H	pirazin-2-ilo	CH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.972	CH ₃	H	3,6-dimetilpirazin-2-ilo	CH ₃
74.973	CH ₃	H	3-cianopirazin-2-ilo	CH ₃
74.974	CH ₃	H	quinolin-2-ilo	CH ₃
74.975	CH ₃	H	3-etilquinolin-2-ilo	CH ₃
74.976	CH ₃	H	bencilo	CH ₃
74.977	CH ₃	H	4-fluorobencilo	CH ₃
74.978	CH ₃	H	4-clorobencilo	CH ₃
74.979	CH ₃	H	4-metilbencilo	CH ₃
74.980	CH ₃	H	2,4-dimetilbencilo	CH ₃
74.981	CH ₃	H	2,4,6-trimetilbencilo	CH ₃
74.982	CH ₃	H	H	CH ₂ OH
74.983	CH ₃	H	H	CH ₂ OCH ₃
74.984	CH ₃	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
74.985	CH ₃	H	H	CHO
74.986	CH ₃	H	H	COCH ₃
74.987	CH ₃	H	H	CO ₂ H
74.988	CH ₃	H	H	CO ₂ CH ₃
74.989	CH ₃	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃
74.990	CH ₃	H	H	CONH ₂
74.991	CH ₃	H	H	CONHCH ₃
74.992	CH ₃	H	H	CONHCH ₂ CH ₃
74.993	CH ₃	H	H	CON(CH ₃) ₂
74.994	CH ₃	H	H	CON-(CH ₂ CH ₃) ₂
74.995	CH ₃	H	H	CON(CH ₃)O-CH ₃
74.996	CH ₃	H	H	CH=NOH
74.997	CH ₃	H	H	CH=NOCH ₃
74.998	CH ₃	H	H	CH=NOCH ₂ -CH ₃
74.999	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=NOH
74.1000	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=NO-CH ₃
74.1001	CH ₃	H	H	CH ₂ OC(O)NH-CH ₃
74.1002	CH ₃	H	H	CH ₂ NH ₂
74.1003	CH ₃	H	H	CH ₂ NHCHO
74.1004	CH ₃	H	H	CH ₂ NHC(O)-CH ₃
74.1005	CH ₃	H	H	CH ₂ NHC(O)OCH ₃

ES 2 497 501 T3

	R ⁶	R ⁸	R ⁹	R ¹¹
74.1006	CH ₃	H	H	NHCO ₂ CH ₃
74.1007	CH ₃	H	H	NHCO ₂ -C(CH ₃) ₃
74.1008	CH ₃	H	H	CH(OH)CH ₃
74.1009	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)OCH ₃
74.1010	CH ₃	H	H	CN
74.1011	CH ₃	H	H	CH ₂ SCH ₃
74.1012	CH ₃	H	H	CH ₂ S(O)CH ₃
74.1013	CH ₃	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃
74.1014	CH ₃	H	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃
74.1015	CH ₃	H	H	CH ₂ S(O)CH ₂ -CH ₃
74.1016	CH ₃	H	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ -CH ₃
74.1017	CH ₃	H	H	OCH ₃
74.1018	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
74.1019	CH ₃	H	H	CH(OCH ₃) ₂
74.1020	CH ₃	H	H	CH-(OCH ₂ CH ₃) ₂
74.1021	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₃
74.1022	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
74.1023	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
74.1024	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
74.1025	CH ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
74.1026	CH ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₃
74.1027	CH ₃	H	H	CH ₂ CN
74.1028	CH ₃	H	H	ciclopropilo
74.1029	CH ₃	H	H	ciclobutilo
74.1030	CH ₃	H	H	ciclopentilo
74.1031	CH ₃	H	H	ciclohexilo
74.1032	CH ₃	H	H	CH ₂ -ciclopropilo
74.1033	CH ₃	H	H	bencilo
74.1034	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃

La Tabla 75 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² y R⁴ son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

5 La Tabla 76 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son etilo, R² es metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 77 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹, R² y R⁴ son etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 101 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es vinilo, R² es metilo, R⁴ es bromo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 102 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es vinilo, R² es metilo, R⁴ es yodo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

5 La Tabla 103 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son vinilo, R² es metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 104 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R², R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

10 La Tabla 105 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es metoxi, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 106 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es trifluorometilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 107 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es etilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

15 La Tabla 108 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es etinilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 109 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es vinilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

20 La Tabla 110 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es cloro, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 111 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es bromo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 112 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es yodo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

25 La Tabla 113 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R², R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 114 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es metoxi, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

30 La Tabla 115 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R² son etilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 116 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es trifluorometilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 117 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es etinilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

35 La Tabla 118 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es vinilo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 119 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es cloro, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

40 La Tabla 120 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es bromo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 121 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es yodo, R³, R⁴, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 122 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son metilo, R² es cloro, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

45 La Tabla 123 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son metilo, R² es bromo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 124 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son metilo, R² es yodo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 125 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es cloro, R³ es hidrógeno, R⁴ es etilo, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

5 La Tabla 126 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es bromo, R³ es hidrógeno, R⁴ es etilo, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 127 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es yodo, R³ es hidrógeno, R⁴ es etilo, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

10 La Tabla 128 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son etilo, R² es cloro, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 129 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son metilo, R² es bromo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 130 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son etilo, R² es yodo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

15 La Tabla 131 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es cloro, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 132 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es bromo, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

20 La Tabla 133 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es cloro, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 134 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es etilo, R² es bromo, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 135 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son metilo, R² es metoxi, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

25 La Tabla 136 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ es metilo, R² es metoxi, R³ es hidrógeno, R⁴ es etilo, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 137 cubre compuestos de fórmula (AH), en la que R¹ y R⁴ son etilo, R² es metoxi, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

30 La Tabla 138 cubre compuestos de fórmula (AH) en la que R¹, R², R³ y R⁴ son metilo, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 139 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es difluorometoxi, R² y R⁴ son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 140 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es difluorometoxi, R² es metilo, R⁴ es etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

35 La Tabla 141 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es trifluorometoxi, R² y R⁴ son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 142 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es trifluorometoxi, R² es metilo, R⁴ es etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

40 La Tabla 143 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es ciclopropilo, R² y R⁴ son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

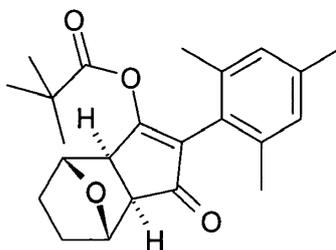
La Tabla 144 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ es ciclopropilo, R² es metilo, R⁴ es etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

La Tabla 145 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ y R² son metilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno, R⁴ es ciclopropilo y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

45 La Tabla 146 cubre compuestos de fórmula (A), en la que R¹ y R² son etilo, R³, R⁵ y R¹² son hidrógeno, R⁴ es ciclopropilo y R⁶, R⁸, R⁹, y R¹¹ son como se definen en la Tabla 74.

Ejemplo 25

Preparación de 2,2-dimetilpropionato de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-5-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-3-en-3-ilo.

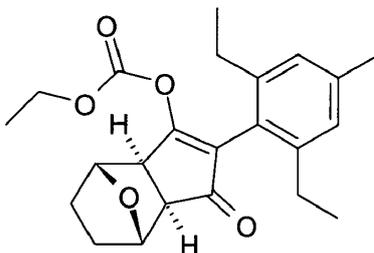


5 Una disolución de cloruro de pivaloilo (0,055 g, 0,57 mmoles) en diclorometano (2 ml) se añade gota a gota a una disolución de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (0,12 g, 0,42 mmoles) en diclorometano (2 ml) a temperatura ambiente, y la mezcla de reacción se agita durante 2 minutos. Se añade una disolución de trietilamina (0,08 ml) en diclorometano (1 ml), y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 3 horas. La mezcla de reacción se diluye con diclorometano (20 ml) y se lavó con disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evaporó a presión reducida para dar 2,2-dimetilpropionato de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-5-oxo-4-(2,4,6-trimetilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-3-en-3-ilo como un aceite incoloro.

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 6,84 (1 H, s), 6,82 (1 H, s), 4,75 (1 H, d), 4,55 (1 H, d), 3,45 (1 H, d), 2,78 (1 H, d), 2,24 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,89 - 1,83 (2H, m), 1,63 - 1,59 (2H, m), 1,11 (9H, s).

Ejemplo 26

15 Preparación de éster (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-5-oxo-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-3-en-3-ílico éster etílico del ácido carbónico.



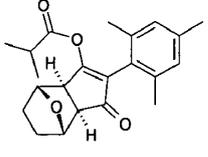
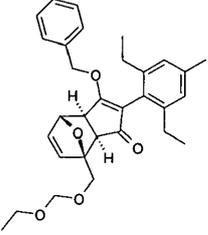
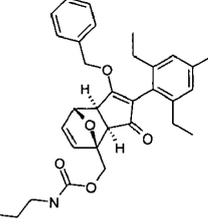
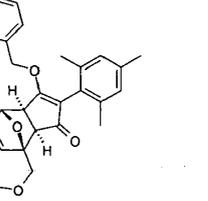
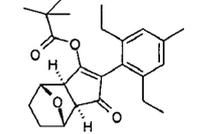
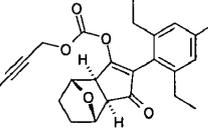
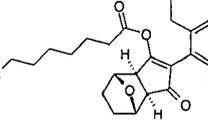
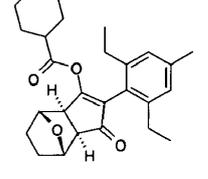
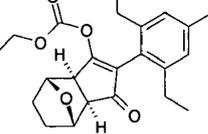
20 Una disolución de cloroformiato de etilo (0,071 g, 0,65 mmoles) en diclorometano (0,5 ml) se añade gota a gota a una disolución de (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decan-3,5-diona (0,172 g, 0,55 mmoles) en diclorometano (2 ml) a 0°C, y la mezcla de reacción se agita. Se añade una disolución de trietilamina (0,066 g, 0,65 mmoles) en diclorometano (1 ml), y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 17 horas, calentando lentamente a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluye con diclorometano (3 ml) y se lavó con disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La fase orgánica se separa, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra, y el filtrado se evaporó a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar éster (1*RS*,2*SR*,6*RS*,7*SR*)-5-oxo-4-(2,6-dietil-4-metilfenil)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-3-en-3-ílico éster etílico del ácido carbónico como un aceite incoloro.

25 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ_H 1,06 (6H,m), 1,28 (3H, t), 1,63 (2H, m), 1,87 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,35 (4H, m), 2,8 (1 H, d), 3,63 (1 H, d), 4,22 (2H, q), 4,64 (1 H, d), 4,77 (1 H, d), 6,91 (2H, d).

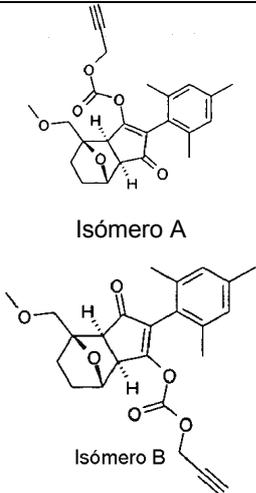
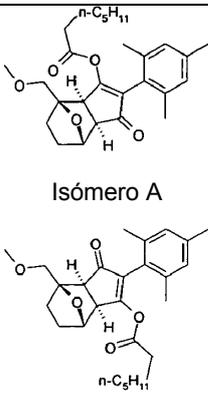
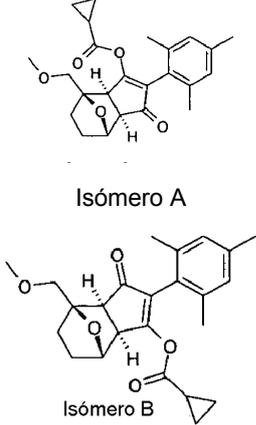
30 Compuestos adicionales en la Tabla P1 más abajo se prepararon mediante métodos similares usando materiales de partida apropiados.

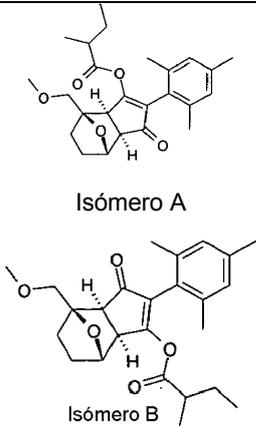
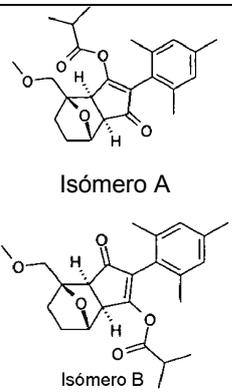
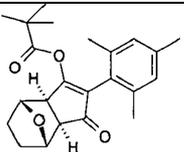
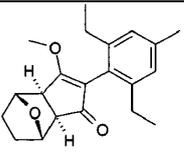
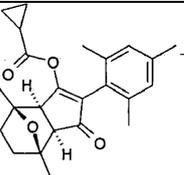
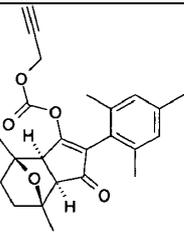
Tabla P1

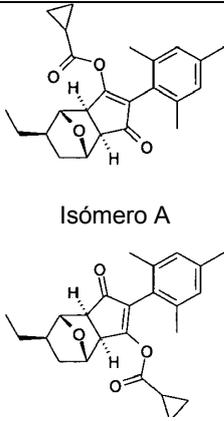
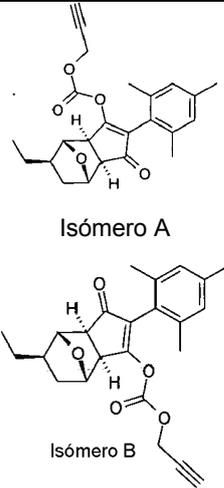
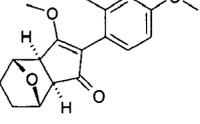
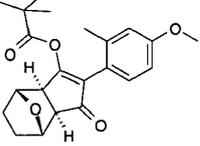
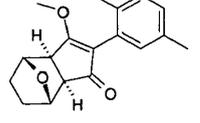
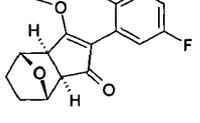
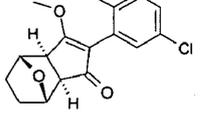
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P1		δ_H 6,90 (2H, s), 6,45 (1H, dd), 6,35 (1H, dd), 5,30 (1H, d), 5,25 (1H, d), 3,65 (3H, s), 3,65 (1H, dd), 3,45 (1H, dd), 2,35 (4H, m), 2,30 (3H, s), 1,10 (6H, m).
P2		δ_H 6,90 (2H, m), 4,85 (2H, m), 3,70 (3H, s), 3,60 (1H, m), 3,35 (1H, dd), 2,50 (2H, m), 2,35 (2H, m), 2,30 (3H, s), 1,90-1,75 (4H, m), 1,20 (3H, t), 1,10 (3H, t)
P3		δ_H 6,87 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,74 (1H, d), 4,68 (2H, t), 4,65 (1H, d), 3,53 (1H, d), 2,79 (1H, d), 2,56 (1H, t), 2,26 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,94 - 1,80 (2H, m), 1,67 - 1,56 (2H, m).
P4		δ_H 6,87 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,85 - 4,78 (1H, m), 4,74 (1H, d), 4,64 (1H, d), 3,51 (1H, d), 2,77 (1H, d), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,93 - 1,79 (2H, m), 1,67 - 1,54 (2H, m), 1,25 (3H, d), 1,20 (3H, d).
P5		δ_H 6,88 (1H, s), 6,86 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,59 (1H, d), 3,56 (1H, d), 2,76 (1H, d), 2,27 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,89 - 1,80 (2H, m), 1,69 - 1,56 (3H, m), 1,01 - 0,92 (4H, m).
P6		δ_H 6,86 (1H, s), 6,84 (1H, s), 4,74 (1H, d), 4,58 (1H, d), 3,48 (1H, d), 2,77 (1H, d), 2,40 - 2,35 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,93 - 1,82 (2H, m), 1,65 - 1,48 (4H, m), 1,31 - 1,17 (6H, m), 0,86 (3H, t).
P7		δ_H 7,38 - 7,37 (3H, m), 7,19 - 7,18 (2H, m), 6,97 (2H, s), 6,68 (1H, dd), 6,55 (1H, d), 5,08 (1H, s with fine splitting), 4,82 - 4,81 (2H, m), 4,13 - 4,10 (1H, m), 4,03 - 4,00 (1H, m), 3,13 (1H, dd), 2,89 (1H, dd), 2,54 - 2,45 (4H, m), 2,37 (3H, s), 1,20 - 1,16 (6H, m).
P8		δ_H 7,35 - 7,32 (3H, m), 7,15 - 7,13 (2H, m), 6,93 (1H, s), 6,92 (1H, s), 6,54 - 6,49 (2H, m), 5,14 (1H, d), 4,71 - 4,64 (2H, m), 4,15 - 4,08 (2H, m), 2,99 (1H, d), 2,84 (1H, d), 2,59 - 2,39 (4H, m), 2,32 (3H, s), 1,17 - 1,13 (6H, m).
P9		δ_H 6,84 (1H, s), 6,82 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,57 - 4,55 (1H, m), 3,46 - 3,44 (1H, m), 2,77 (1H, d), 2,46 - 2,35 (1H, m), 2,23 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,92 - 1,80 (2H, m), 1,04 (3H, d), 0,93 (3H, t).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P10		δ_H 6,86 (1H, s), 6,84 (1H, s), 4,74 (1H, d), 4,56 (1H, d), 3,49 (1H, d), 2,78 (1H, d), 2,65 - 2,58 (1H, m), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,93 - 1,79 (2H, m), 1,66 - 1,56 (2H, m), 1,13 (3H, d), 1,06 (3H, d).
P11		δ_H 7,34 - 7,31 (3H, m), 7,15 - 7,12 (2H, m), 6,90 (2H, s), 6,50 (2H, s), 5,05 (1H, s), 4,79 - 4,72 (4H, m), 4,23 (1H, d), 3,97 (1H, d), 3,65 - 3,58 (2H, m), 3,06 (1H, d), 2,66 (1H, d), 2,54 - 2,34 (4H, m), 2,31 (3H, s), 1,20 (3H, t), 1,15 - 1,10 (6H, m).
P12		δ_H 7,33 - 7,30 (3H, m), 7,14 - 7,12 (2H, m), 6,90 (2H, s), 6,51 (1H, dd), 6,45 (1H, d), 5,11 (1H, d), 5,05 (1H, d), 4,81 - 4,76 (1H, m), 4,73 - 4,72 (2H, m), 4,30 (1H, d), 3,17 - 3,12 (2H, m), 3,06 (1H, d), 2,69 (1H, d), 2,52 - 2,35 (4H, m), 2,31 (3H, s), 1,53 - 1,47 (2H, m), 1,15 - 1,11 (6H, m), 0,90 (3H, t).
P13		δ_H 7,33 - 7,30 (3H, m), 7,15 - 7,11 (2H, m), 6,86 (2H, s), 6,50 - 6,49 (2H, m), 5,11 (0,5H, s), 5,04 (0,5H, s), 4,76 - 4,66 (2H, m), 4,16 - 4,11 (1H, m), 3,77 - 3,74 (1H, m), 3,43 (1,5H, s), 3,34 (1,5H, s), 3,03 (0,5H, s), 2,94 (0,5H, s), 2,77 (0,5H, d), 2,62 (0,5H, d), 2,27 (1,5H, s), 2,19 (1,5H, s), 2,12 (1,5H, s), 2,08 (1,5H, s), 2,07 (3H, s).
P14		δ_H 1,04 (6H, m), 1,08 (9H, s), 1,6 (2H, m), 1,85 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,33 (4H, m), 2,79 (1H, d), 3,58 (1H, d), 4,54 (1H, d), 4,74 (1H, d), 6,85 (1H, s), 6,88 (1H, s).
P15		δ_H 1,04 (6H, m), 1,6 (2H, m), 1,85 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,35 (4H, m), 2,8 (1H, d), 3,63 (1H, d), 4,66 (1H, d), 4,7 (1H, s), 4,75 (1H, d), 6,9 (2H, s).
P16		δ_H 1,04 (6H, m), 1,2 (3H, m), 1,35 (1H, m), 1,6 (8H, m), 1,85 (2H, m), 2,32 (9H, m), 2,8 (1H, d), 3,58 (1H, d), 3,67 (3H, s), 4,58 (1H, d), 4,75 (1H, d), 6,9 (2H, s).
P17		δ_H 1,04 (6H, m), 1,3 - 1,8 (14H, m), 2,3 (3H, s), 2,34 (5H, m), 2,79 (1H, d), 3,6 (1H, d), 4,54 (1H, d), 4,75 (1H, d), 6,89 (2H, d).
P18		δ_H 1,06 (6H, m), 1,28 (3H, t), 1,63 (2H, m), 1,87 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,35 (4H, m), 2,8 (1H, d), 3,63 (1H, d), 4,22 (2H, q), 4,64 (1H, d), 4,77 (1H, d), 6,91 (2H, d).

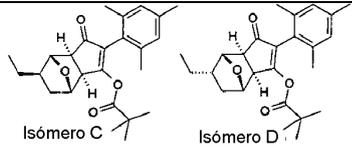
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P19		δ_H 0,85 (6H, d), 1,05 (6H, m), 1,61 (2H, m), 1,85 (2H, m), 1,98 (1H, m), 2,28 (2H, d), 2,3 (3H, s), 2,35 (4H, m), 2,8 (1H, d), 3,58 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,75 (1H, d), 6,89 (2H, d).
P20		δ_H 0,84 (3H, t), 1,05 (6H, m), 1,23 (8H, m), 1,62 (2H, m), 1,86 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,37 (6H, m), 2,8 (1H, d), 3,59 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,75 (1H, d), 6,9 (2H, d).
P21		δ_H 0,95 (4H, m), 1,05 (6H, m), 1,63 (3H, m), 1,85 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,35 (4H, m), 2,77 (1H, d), 3,65 (1H, d), 4,59 (1H, d), 4,74 (1H, d), 6,9 (2H, d)
P22		δ_H 1,07 (9H, m), 1,6 (2H, m), 1,85 (2H, m), 2,31 (3H, s), 2,39 (6H, m), 2,79 (1H, d), 3,62 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,74 (1H, d), 6,9 (2H, d).
P23		δ_H 1,06 (6H, m), 1,62 (2H, m), 1,87 (2H, m), 2,3 (3H, s), 2,35 (4H, m), 2,8 (1H, d), 3,52 (1H, d), 4,62 (3H, m), 4,75 (1H, d), 5,31 (2H, m), 5,85 (1H, m), 6,91 (2H, d).
P24		δ_H 0,9 (6H, d), 1,07 (6H, m), 1,61 (2H, m), 1,86 (2H, m), 1,92 (1H, m), 2,31 (3H, s), 2,32 (4H, m), 2,8 (1H, d), 3,52 (1H, d), 3,94 (2H, m), 4,64 (1H, d), 4,76 (1H, d), 6,91 (2H, d).
P25		δ_H 1,07 (6H, m), 1,62 (2H, m), 1,87 (2H, m), 2,31 (3H, s), 2,36 (4H, m), 2,56 (1H, m), 2,81 (1H, d), 3,63 (1H, d), 4,67 (1H, d), 4,75 (2H, m), 6,9 (2H, d).
P26		δ_H 1,05 (9H, m), 1,13 (3H, d), 1,61 (2H, m), 1,87 (2H, m), 2,31 (3H, s), 2,36 (4H, m), 2,6 (1H, m), 2,79 (1H, d), 3,61 (1H, d), 4,57 (1H, d), 4,76 (1H, d), 6,89 (2H, d).
P27	<p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_H 6,87 - 6,86 (2H, m), 4,84 - 4,77 (1H, m), 4,60 (1H, d), 3,89 (1H, d), 3,70 (1H, d), 3,60 (1H, d), 3,41 (3H, s), 2,80 (1H, d), 2,25 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,03 - 1,96 (2H, m), 1,72 - 1,65 (2H, m), 1,25 (3H, d), 1,19 (3H, d).

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P28	 <p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_H 6,88 - 6,86 (2H, m), 4,74 - 4,60 (3H, m), 3,89 - 6,63 (3H, m), 3,41 (3H, s), 2,92 (0,5H, d), 2,83 - 2,81 (0,5H, m), 2,56 - 2,55 (1H, m), 2,26 (3H, s), 2,10 (1,5H, s), 2,09 (1,5H, s), 2,04 (1,5H, s), 2,03 (1,5H, s), 2,00 - 1,65 (4H, m).</p>
P29	 <p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_H 6,86 - 6,84 (2H, m), 4,55 (1H, d), 3,89 (1H, d), 3,70 (1H, d), 3,59 (1H, d), 3,41 (3H, s), 2,81 (1H, d), 2,39 - 2,33 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,03 (3H, s), 2,00 - 1,95 (1H, m), 1,66 - 1,49 (3H, m), 1,38 - 1,13 (8H, m), 0,90 - 0,84 (3H, m).</p>
P30	 <p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_H 6,88 - 6,86 (2H, m), 4,55 (1H, d), 3,89 (1H, d), 3,71 - 3,65 (2H, m), 3,41 (3H, s), 2,79 (1H, d), 2,27 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,78 - 1,50 (4H, m), 1,07 - 1,04 (1H, m), 0,99 - 0,91 (4H, m).</p>

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P31	 <p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_{H} 6,84 - 6,82 (2H, m), 4,54 - 4,52 (1H, m), 3,89 (1H, d), 3,70 (1H, d), 3,56 (1H, t), 3,40 (3H, s), 2,80 (1H, d), 2,44 - 2,37 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,71 - 1,35 (6H, m), 1,17 - 1,02 (3H, m), 0,95 - 0,67 (3H, m).</p>
P32	 <p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_{H} 6,85 - 6,83 (2H, m), 4,52 (1H, d), 3,89 (1H, d), 3,70 (1H, d), 3,58 (1H, d), 3,40 (3H, s), 2,80 (1H, d), 2,62 - 2,57 (1H, m), 2,24 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,71 - 1,52 (4H, m), 1,11 (3H, t), 1,04 (3H, d).</p>
P33		<p>δ_{H} 6,84 (1H, s), 6,82 (1H, s), 4,75 (1H, d), 4,55 (1H, d), 3,45 (1H, d), 2,78 (1H, d), 2,24 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,89-1,83 (2H, m), 1,63 - 1,59 (2H, m), 1,11 (9H, s).</p>
P34		<p>δ_{H} 6,90 (1H, s), 6,89 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,66 (1H, d), 3,58 (3H, s), 2,91 (1H, d), 2,66 (1H, d), 2,49 - 2,39 (4H, m), 2,30 (3H, s), 1,88 - 1,81 (2H, m), 1,62 - 1,56 (2H, m), 1,12 - 1,08 (3H, m).</p>
P35		<p>δ_{H} 6,93 (2H, br. s), 3,71 - 3,69 (1H, m), 2,81 = 2,80 (1H, m), 2,33 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,08 (3H, s), 1,87 - 1,72 (5H, m), 1,64 - 1,60 (6H, m), 1,05 - 0,99 (4H, m).</p>
P36		<p>δ_{H} 6,88 (1H, s), 6,86 (1H, s), 4,71 (1H, dd), 4,61 (1H, dd), 3,65 (1H, d), 2,77 (1H, d), 2,55 (1H, t), 2,26 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,82 - 1,71 (4H, m), 1,56 (3H, s), 1,53 (3H, s).</p>

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P37	 <p style="text-align: center;">Isómero A</p> <p style="text-align: center;">Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_H 6,87 (1H, s), 6,85 (1H, s), 4,70 (0,5H, d), 4,55 (0,5H, d), 4,43 (1H, s), 4,26 (1H, s), 3,53 (1H, app t), 2,74 (1H, app t), 2,26 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,82 - 1,63 (3H, m), 1,49 - 1,41 (2H, m), 1,30 - 1,26 (1H, m), 0,98 - 0,90 (7H, m).</p>
P38	 <p style="text-align: center;">Isómero A</p> <p style="text-align: center;">Isómero B</p>	<p>Relación aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B δ_H 6,87 (1H, s), 6,86 (1H, s), 4,72 - 4,60 (3H, m), 4,45 (0,5H, s), 4,33 (0,5H, d), 3,77 (1H, s), 3,50 (1H, d), 2,79 - 2,76 (0,5H, m), 2,56 - 2,54 (0,5H, m), 2,26 (3H, s), 2,08 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,84 - 1,75 (2H, m), 1,52 - 1,42 (2H, m), 1,30 - 1,24 (1H, m), 0,96 - 0,83 (3H, m).</p>
P39		<p>δ_H 7,01 (1H, br. s), 6,76 (1H, d), 6,72 (1H, dd), 4,72 (1H, d), 4,65 (1H, d), 3,78 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,88 (1H, d), 2,64 (1H, d), 2,15 (3H, s), 1,80 - 1,89 (2H, m), 1,56 - 1,62 (2H, m).</p>
P40		<p>δ_H 6,91 (1H, br. s), 6,76 (1H, s), 6,70 (1H, d), 4,73 (1H, d), 4,53 (1H, d), 3,78 (3H, s), 3,43 (1H, s), 2,75 (1H, d), 2,15 (3H, s), 1,93-1,79 (2H, m), 1,65-1,58 (2H, m), 1,16 (9H, s).</p>
P41		<p>δ_H 7,11-7,05 (1H, m), 7,03-6,99 (1H, m), 6,89 (1H, br. s), 4,73 (1H, d), 4,65 (1H, d), 3,64 (1H, s), 2,89 (1H, d), 2,64 (1H, d), 2,28 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,92-1,78 (2H, m), 1,63-1,57 (2H, m).</p>
P42		<p>δ_H 7,19 (1H, dd), 6,96 (1H, td), 6,91-6,86 (1H, m), 4,77 (1H, d), 4,70 (1H, d), 3,72 (3H, s), 2,96 (1H, d), 2,70 (1H, d), 2,18 (3H, s), 1,97-1,82 (2H, m), 1,68-1,62 (2H, m).</p>
P43		<p>δ_H 7,16 - 7,10 (1H, m), 7,08-7,03 (1H, m), 6,94 (1H, br. s), 4,77 (1H, d), 4,70 (1H, d), 3,68 (3H, s), 2,93 (1H, d), 2,72-2,66 (1H, m), 2,17 (3H, s), 1,97-1,80 (2H, m), 1,62-1,58 (2H, m).</p>

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
P44		δ_H 7,09 (1H, d), 7,04-6,99 (1H, m), 6,76 (1H, br. s), 4,75 (1H, d), 4,54 (1H, d), 3,49-3,41 (1H, m), 2,76 (1H, d), 2,26 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,94-1,79 (2H, m), 1,67-1,59 (2H, m), 1,15 (9H, s).
P45		δ_H 7,16 (1H, dd), 6,92 (1H, td), 6,74 (1H, br. s), 4,75 (1H, d), 4,54 (1H, d), 3,46 (1H, d), 2,77 (1H, d), 2,17 (3H, s), 1,93-1,82 (2H, m), 1,67-1,57 (2H, m), 1,17 (9H, s).
P46		δ_H 7,21 - 7,17 (1H, m), 7,16-7,12 (1H, m), 6,96 (1H, br. s), 4,74 (1H, d), 4,54 (1H, s), 3,45 (1H, d), 2,77 (1H, d), 2,17 (3H, s), 1,94-1,80 (2H, m), 1,67-1,58 (2H, m), 1,17 (9H, s).
P47		δ_H 6,58 (2H, d), 4,74 (1H, d), 4,55 (1H, d), 3,76 (3H, s), 3,43 (1H, d), 2,82-2,73 (1H, m), 2,11 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,93-1,78 (2H, m), 1,66-1,57 (2H, m), 1,11 (9H, s).
P48		δ_H 7,33 (1H, d), 7,29 (1H, br. s), 7,23 (1H, dd), 4,75 (1H, d), 4,67 (1H, d), 3,76 (3H, s), 2,94 (1H, s), 2,69 (1H, s), 1,93-1,79 (2H, m), 1,65-1,54 (2H, m).
P49		δ_H 6,60 (2H, d), 4,72 (1H, d), 4,65 (1H, d), 3,76 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,88 (1H, d), 2,64 (1H, d), 2,13 (3H, s), 2,10 (3H, s), 1,90-1,77 (2H, m), 1,64-1,54 (2H, m).
P50		δ_H 7,14 (2H, d), 5,34 (1H, s), 5,04 (1H, s), 4,73 (1H, d), 4,66 (1H, d), 3,58 (3H, s), 2,90 (1H, d), 2,66 (1H, d), 2,17 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,92-1,75 (2H, m), 1,66-1,54 (2H, m).
P51	<p>Isómero A</p> <p>Isómero B</p>	<p>Mezcla aproximadamente 1:1 de Isómero A: Isómero B</p> <p>Isómero A: δ_H 7,81 (2H, s), 6,87 (1H, s), 6,83 (1H, s), 4,83 (1H, d), 4,69 (1H, s), 3,64 (1H, d), 3,22 (1H, dd), 2,99 (1H, d), 2,38 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,99 - 1,96 (1H, m), 1,23 (3H, s), 1,13 (6H, s).</p> <p>Isómero B: δ_H 7,84 (2H, s), 6,87 (1H, s), 6,84 (1H, s), 4,99 (1H, d), 4,50 (1H, s), 3,64 (1H, d), 3,24 (1H, dd), 2,94 (1H, d), 2,35 (1H, dd), 2,25 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,91 - 1,89 (1H, m), 1,07 (9H, s).</p>
P52		Mezcla aproximadamente 1:1:1:1 de Isómero A: Isómero B: Isómero C: Isómero D

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que se señale) u otros datos físicos
	 <p>Isómero C Isómero D</p>	δ_H 6,84 (1H, s), 6,82 (1H, s), 4,71 (0,25H, d), 4,68 (0,25H, d), 4,60 (0,25H, d), 4,52 (0,25H, d), 4,48 (0,25H, d), 4,45 (0,25H, s), 4,41 (0,25H, d), 4,23 (0,25H, s), 3,79 (0,25H, d), 3,43 (0,5H, t), 3,04 (0,25H, d), 2,77 - 2,73 (0,75H, m), 2,24 (3H, s), 2,19-2,11 (1H, m), 2,09 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,84 - 1,73 (1H, m), 1,52 - 1,39 (2H, m), 1,28 - 1,26 (1H, m), 1,12 - 1,10 (9H, m), 1,00 - 0,90 (3H, m).

Ejemplos biológicos

Ejemplo 1 de ensayo

5 Se sembraron en macetas plantas de ensayo monocotiledóneas y dicotiledóneas en suelo estándar. Después de cultivar durante un día (pre-emergencia) o después de 10 días de cultivo (post-emergencia) en condiciones controladas en un invernadero, las plantas se pulverizaron con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del ingrediente activo de calidad técnica en 0,6 ml de acetona y 45 ml de disolución de formulación que contiene 10,6% de Emulsogen EL (nº de Registro 61791-12-6), 42,2% de N-metilpirrolidona, 42,2% de éter monometílico de dipropilenglicol (nº de Registro 34590-94-8) y 0,2% de X-77 (nº de Registro 11097-66-8). Después, 10 las plantas de ensayo se hicieron crecer en un invernadero en condiciones óptimas hasta; el ensayo se evaluó 15 días después para la post-emergencia y 20 días para la pre-emergencia (100 = daño total a la planta; 0 = ningún daño a la planta). Plantas de ensayo:

Alopecurus myosuroides (ALOMY), *Avena fatua* (AVEFA), *Lolium perenne* (LOLPE), *Setaria faberi* (SETFA), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG)

15 Actividad pre-emergencia

Compuesto nº	Tasa g/ ha	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T1	250	100	100	100	100	100	100
T2	250	100	100	100	90	100	100
T3	250	90	80	100	70	80	100
T4	250	90	90	100	90	100	100
T5	250	100	80	100	80	100	100
T6	250	80	30	100	80	90	90
T7	250	100	80	100	90	80	90
T8	250	100	90	100	100	100	100
T9	250	70	40	100	100	100	100
T10	250	80	70	100	80	80	90
T11	250	30	40	60	20	0	30.
T12	250	10	10	40	40	40	0
T13	250	80	80	90	100	100	100
T14	250	90	90	100	100	70	90
T15	250	40	20	40	60	30	80

ES 2 497 501 T3

Compuesto nº	Tasa g/ ha	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T16	250	0	10	0	10	0	0
T17	250	100	90	100	100	100	100
T18	250	100	100	100	100	100	100
T19	250	100	90	100	100	90	100
T21	250	90	30	80	70	10	80
T27	250	70	70	70	100	90	100
T34	250	70	30	60	80	60	40
T37	250	60	30	30	0	20	30
T39	250	10	20	30	40	30	30
T40	250	50	60	60	40	60	40
T41	250	50	30	20	60	30	70
T42	250	0	10	0	0	0	30
T43	250	10	20	0	50	20	0
T44	250	80	40	70	80	80	70
T46	250	10	0	30	30	20	70
T47	250	100	80	100	80	70	100
T48	250	100	80	100	100	100	100
T49	250	80	70	100	20	10	80
T52	250	40	30	100	90	90	100
T53	250	10	20	10	10	10	0
T56	250	100	60	100	70	70	100
T57	250	50	30	100	80	60	70
T58	250	0	10	0	0	0	60
T59	250	10	20	30	40	50	30
T60	250	0	40	10	10	30	30
T62	250	70	70	60	80	80	80
T64	250	0	0	10	20	10	50
T65	250	100	90	100	90	100	100
T66	250	30	60	40	100	90	70
T70	250	80	50	100	90	90	100
T71	250	30	0	0	20	50	50
T85	250	40	60	70	70	60	70

ES 2 497 501 T3

Compuesto nº	Tasa g/ ha	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T89	250	20	60	40	30	30	20
T90	250	10	60	20	40	60	70
T91	250	20	50	20	50	70	50
T92	250	20	60	30	70	70	90
T93	250	40	30	20	30	30	0
T97	250	100	90	100	90	100	100
T98	250	30	20	20	70	0	30
T99	250	80	60	100	80	80	100
T106	250	90	90	100	100	100	100
T107	250	90	90	100	100	100	100
T125	250	70	70	100	100	100	100
T128	250	70	70	90	100	100	100
T129	250	100	90	90	100	90	100
T134	250	60	20	70	0	50	20
T143	250	50	20	70	70	80	10
T146	250	70	60	90	80	80	80
T147	250	40	0	40	60	40	90
T148	250	60	50	70	60	70	80
T149	250	90	60	80	80	70	90
T150	250	0	0	30	0	0	40
T151	250	50	20	60	20	80	40
T153	250	70	70	80	70	60	70
T154	250	70	50	80	70	70	100
T155	250	60	50	80	60	70	60
T156	250	70	60	70	70	70	70
T157	250	30	-	70	0	0	50
T158	250	60	50	70	70	70	50
T159	250	50	60	40	70	70	70
T160	250	30	50	40	70	40	40
T162	250	70	70	90	10	40	80
T163	250	70	60	90	90	90	80
T165	250	70	20	80	70	50	80

ES 2 497 501 T3

Compuesto nº	Tasa g/ ha	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T167	250	30	40	40	0	30	50
T169	250	20	30	40	0	0	0
T170	250	80	40	90	70	70	80
T171	250	30	0	10	70	40	70
T173	250	90	70	100	60	70	70
T174	250	30	30	30	0	40	0
T177	250	60	50	70	50	10	70
T178	250	70	40	80	100	80	100
T179	250	70	60	80	10	60	70
T180	250	30	20	70	40	80	60
T181	250	40	40	80	70	90	100
T182	250	30	50	40	50	80	90
T184	250	30	60	70	90	70	60
T185	250	80	80	100	80	80	80
T187	250	10	20	60	40	20	10
T188	250	40	0	50	70	100	60
T193	250	20	30	60	40	20	20
T194	250	0	20	20	50	70	50
T199	250	0	50	60	60	100	80
T200	250	0	0	70	70	70	90
T203	250	20	20	60	70	70	90
T208	250	50	70	80	80	70	80
P3	250	100	100	100	90	90	100
P4	250	100	100	100	70	90	90
P5	250	100	100	100	90	100	90
P6	250	100	100	100	80	100	90
P9	250	100	100	100	80	90	80
P10	250	100	100	100	80	100	100
P14	250	100	100	100	100	100	100
P15	250	80	90	90	100	100	100
P16	250	100	90	90	100	100	100

ES 2 497 501 T3

Compuesto nº	Tasa g/ ha	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
P17	250	90	90	100	100	100	100
P18	250	100	100	100	100	100	100
P19	250	100	100	100	100	100	100
P20	250	100	80	100	100	100	100
P21	250	100	100	100	100	100	100
P22	250	100	100	100	100	100	100
P23	250	80	90	100	100	100	100
P24	250	90	90	100	100	100	100
P25	250	100	100	100	100	100	100
P26	250	100	90	100	100	100	100
P27	250	90	80	90	80	90	100
P28	250	90	80	100	80	90	80
P30	250	80	80	90	80	80	90
P33	250	90	70	100	80	80	-
P36	250	70	80	100	80	80	100
P37	250	90	90	100	100	100	100

Actividad post-emergencia

Compuesto nº	Tasa g/ ha	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T1	125	90	90	80	100	100	100
T2	125	100	90	100	80	100	100
T3	125	60	30	60	90	100	100
T4	125	80	90	90	80	80	100
T5	125	70	70	80	90	100	100
T6	125	80	80	80	80	90	90
T7	125	100	90	90	90	70	90
T8	125	100	100	100	100	100	100
T9	125	80	60	70	80	100	100
T10	125	70	70	80	80	50	80

ES 2 497 501 T3

T11	125	40	20	30	70	80	70
T12	125	70	50	10	70	70	70
T13	125	80	90	90	100	50	100
T14	125	80	80	80	100	90	100
T15	125	50	40	40	50	80	80
T16	125	40	20	50	0	0	30
T17	125	100	100	90	100	100	100
T18	125	100	100	80	100	100	100
T19	125	100	100	90	100	90	100
T21	125	90	70	70	60	30	100
T27	125	100	90	80	100	100	100
T34	125	40	30	30	80	80	80
T37	125	50	20	20	70	50	80
T39	125	10	20	0	60	70	70
T40	125	40	30	30	70	70	70
T41	125	40	0	0	80	80	80
T42	125	0	0	10	0	20	60
T43	125	10	0	0	40	20	60
T44	125	80	50	20	80	80	90
T46	125	0	0	0	60	0	80
T47	125	100	90	90	70	60	100
T48	125	80	70	70	90	100	100
T49	125	80	80	70	50	70	80
T52	125	60	70	70	80	80	100
T56	125	100	50	80	60	70	100
T57	125	70	70	40	70	70	80
T58	125	0	10	0	30	40	30
T59	125	50	40	0	70	80	80
T60	125	10	0	0	40	50	0
T62	125	60	0	20	70	70	80
T64	125	10	0	0	30	60	50
T65	125	90	90	80	100	100	100
T66	125	80	80	50	80	90	80
T70	125	90	70	70	70	70	80
T71	125	50	10	20	50	70	60

ES 2 497 501 T3

T85	125	90	20	70	70	20	100
T89	125	80	80	80	90	90	100
T90	125	90	80	60	60	80	80
T91	125	90	90	50	100	100	100
T92	125	100	100	50	100	100	100
T93	125	60	80	60	100	100	100
T97	125	90	90	80	100	100	100
T98	125	70	20	40	70	60	80
T99	125	80	30	10	70	60	100
T106	125	90	80	80	90	80	100
T107	125	100	90	90	100	100	100
T125	125	80	70	70	80	80	90
T128	125	80	90	80	100	100	100
T129	125	80	80	70	100	80	100
T134	125	20	20	20	50	20	70
T143	125	40	60	30	40	60	70
T146	125	80	80	90	70	70	100
T147	125	90	90	40	70	100	90
T149	125	80	90	70	70	80	100
T150	125	60	60	40	90	30	100
T151	125	80	80	30	10	70	80
T153	125	50	80	50	20	30	70
T154	125	90	60	60	70	70	100
T155	125	90	70	60	100	100	100
T156	125	90	80	70	100	70	100
T157	125	60	60	40	60	60	100
T158	125	90	90	80	100	100	100
T159	125	90	70	40	100	100	100
T160	125	90	90	70	100	100	100
T162	125	90	90	70	100	100	100
T163	125	80	80	80	90	70	100
T165	125	80	30	80	90	70	100
T167	125	80	50	50	70	70	100
T169	125	90	10	30	60	40	80
T170	125	80	70	80	40	40	100

ES 2 497 501 T3

T171	125	70	60	20	90	80	100
T173	125	100	90	90	90	70	100
T174	125	70	70	40	50	70	80
T177	125	80	70	30	20	30	80
T178	125	100	90	90	100	100	100
T179	125	80	80	80	10	50	70
T180	125	90	70	70	100	90	100
T181	125	90	90	80	100	80	100
T182	125	100	90	80	100	100	100
T184	125	10	0	10	50	20	100
T185	125	90	80	80	100	100	100
T187	125	70	10	40	60	60	70
T188	125	80	70	30	70	100	100
T193	125	60	40	30	30	60	60
T194	125	30	0	20	0	70	80
T199	125	100	100	60	80	100	100
T200	125	70	80	80	100	100	100
T203	125	20	10	10	0	50	50
T208	125	70	70	80	70	50	80
P3	125	100	90	100	80	70	100
P4	125	100	90	100	90	80	100
P5	125	100	90	100	80	60	100
P6	125	100	90	100	80	80	100
P9	125	100	90	100	80	80	90
P10	125	100	90	100	80	80	100
P14	125	90	90	90	100	100	100
P15	125	100	90	90	80	80	100
P16	125	100	90	100	100	100	100
P17	125	100	90	100	100	100	100
P18	125	90	50	80	70	70	100
P19	125	100	100	100	100	100	100
P20	125	100	100	100	90	80	100
P21	125	90	100	100	100	80	100
P22	125	100	100	100	100	100	100
P23	125	100	90	90	80	70	100

P24	125	100	100	100	100	70	100
P25	125	100	90	100	80	80	100
P26	125	100	100	90	100	100	100
P24	125	80	60	70	90	100	90
P28	125	80	80	70	80	80	100
P30	125	80	NC	70	80	90	100
P33	125	80	70	80	70	70	90
P36	125	60	70	60	80	80	90
P37	125	90	80	90	100	90	100

Ejemplo 2 de ensayo

5 Los compuestos de ensayo se aplicaron post-emergencia a 60 g de ia/ha, solo y en combinación con cloquintocet-mexilo a 60 g de ia/ha; el adyuvante Adigor (0,5%) se incluyó para cada tratamiento. El volumen de la aplicación fue 200 l/ha. Las plantas diana fueron plántulas de 2-3 hojas de trigo de invierno "Hereward" y cebada de invierno "Antoniya" que se hicieron crecer en un invernadero en condiciones ambientales. Las evaluaciones se realizaron a 14-21 días después de la aplicación.

Compuesto	Tasa (g / ha)	Cloquintocet-mexilo (g / ha)	Lesión de la cosecha (%)	
			Trigo	Cebada
T1	60	0	85	99
	60	60	18	73
T3	60	0	28	5
	60	60	0	5
Mezcla 1:1 de T106: T107	60	0	63	85
	60	60	23	45

Ejemplo 3 de ensayo

10 El compuesto de ensayo T1 se aplicó a 100 y 200 g de ia/ha, solo o en combinación con un intervalo de protectores como mezclas 1:1 (por ejemplo a 100 g + 100 g; 200 g + 200 g) a las plantas de ensayo – trigo y maíz – en la etapa de 2-3 hoja. También se aplicó una mezcla de protectores de 4 vías (cloquintocet-mexilo, benoxacor, fluxofenim y compuesto A*) con el compuesto de ensayo, de manera que cada protector se usó a una relación 1:1 (por ejemplo a 100+100+100+100+100 g de ia/ha). Las evaluaciones se realizaron a 14-21 días después de la aplicación.

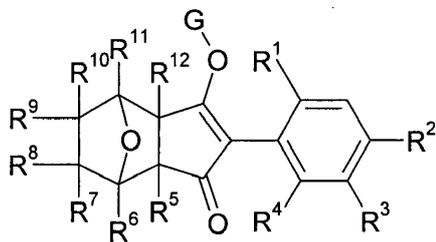
Muestra de ensayo	Lesión del trigo (%)		Lesión del maíz (%)	
	100 g/ha	200 g/ha	100 g/ha	200 g/ha
T1 solo	83	92	90	100
T1 + benoxacor a una relación 1:1	80	85	90	75
T1 + cloquintocet-mexilo a una relación 1:1	5	10	93	95
T1 + isoxadifeno a una relación 1:1	65	73	65	75
T1 + ciprosumfida a una relación 1:1	68	85	23	28
T1 + compuesto A* a una relación 1:1	73	88	30	35

ES 2 497 501 T3

T1 + fluxofenim a una relación 1:1	75	90	85	88
T1 + mefenpir-dietilo a una relación 1:1	23	45	100	100
T1+ diclormida a una relación 1:1	73	73	80	100
T1 + mezcla de 4 vías a una relación 1:1:1:1	0	20	30	50
* El compuesto A es N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida.				

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I



(I),

en la que

- 5 G es hidrógeno o un metal alcalino, metal alcalino-térreo, sulfonio, amonio o un grupo protector, en el que el grupo protector es como se define aquí,
- R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, etinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂,
- 10 R², R³ y R⁴ son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, etinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂,
- R⁵ y R¹² son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, halógeno o alcoxi C₁-C₆-carbonilo, o
- R⁵ y R¹², unidos juntos, forman un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno o de azufre, y
- 15 y en la que
- R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, formilo, ciano o nitro, o
- R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₃-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o
- 20 R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, un grupo COR¹³, CO₂R¹⁴ o CONR¹⁵R¹⁶, CR¹⁷=NOR¹⁸, CR¹⁹=NNR²⁰R²¹, NHR²², NR²²R²³ o OR²⁴, en los que
- R¹³ es alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,
- 25 R¹⁴ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o es heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,
- R¹⁵ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y
- 30 R¹⁶ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilsulfonilo, heteroarilsulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o amino, o
- 35 R¹⁵ y R¹⁶ se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, y
- R¹⁷ y R¹⁹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃ o cicloalquilo de C₃-C₆,
- R¹⁸, R²⁰ y R²¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo o heteroarilo, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o aminocarbonilo, y
- 40

R²² es alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilcarbonilo, fenoxicarbonilo, fenilaminocarbonilo, feniltiocarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilcarbonilo, heteroariloxicarbonilo, heteroarilaminocarbonilo, heteroariltiocarbonilo o heteroarilsulfonilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

5 R²³ es alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o R²² y R²³ se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

10 R²⁴ es alquenilo de C₃-C₆, alquinio de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o aminocarbonilo;

y en la que

R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, formilo, amino, ciano o nitro, o

15 R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-tio-alquilo de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonil-alquilo de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonil-alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₄-C₇, tri(alquil C₁-C₆)sililo, arilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

20 R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, un grupo COR^{13A}, CO₂R^{14A} o CONR^{15A}R^{16A}, CR^{17A}=NOR^{18A}, CR^{19A}=NNR^{20A}R^{21A}, NR^{22A}R^{23A} o OR^{24A}, o

R⁷ y R⁸, o R⁹ y R¹⁰, forman juntos una unidad =O, o forman una unidad =CR²⁵R²⁶, o forman una unidad =NR²⁷,

25 o cualesquiera dos de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ forman un anillo de 3 a 8 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S y N y opcionalmente sustituido con: alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfonilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, haloalquilo de C₁-C₃, halógeno, fenilo; fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, halógeno, ciano o con nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, halógeno, ciano o con nitro,

30 o R⁷ y R¹⁰ forman juntos un enlace;

y en la que

35 R^{13A} es alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

R^{14A} es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o es heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos,

40 R^{15A} es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

45 R^{16A} es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, cicloalquenilo de C₅-C₇, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, fenilo, heteroarilo o un heterociclilo de 3 a 7 miembros, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o amino, o

R^{15A} y R^{16A} se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, y

R^{17A} y R^{19A} son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₃ o cicloalquilo de C₃-C₆,

50 R^{18A}, R^{20A} y R^{21A} son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo o heteroarilo, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

R^{22A} y R^{23A} son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, fenilo o heteroarilo, o

5 R^{22A} y R^{23A} se unen para formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, y

10 R^{24A} es alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₃-C₆, alquinilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, fenilo o heteroarilo, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos;

y en la que

R²⁵ y R²⁶ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano o nitro, o

15 R²⁵ y R²⁶ son, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-fenil-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-fenil-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-heteroaril-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, *N*-heteroaril-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, fenilo, heteroarilo, cicloalquilo de C₃-C₈ o heterociclilo de 3 a 7 miembros, en los que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos, o

R²⁵ y R²⁶ se unen juntos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S o N y opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₂ o alcoxi de C₁-C₂, y

20 R²⁷ es nitro o ciano, o

R²⁷ es alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alcoxi de C₁-C₆, alquenil C₃-C₆-oxi, alquinil C₃-C₆-oxi, fenoxi, fenilamino, *N*-fenil-*N*-alquil C₁-C₆-amino, *N*-fenil-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-amino, heteroariloxi, heteroarilamino, *N*-heteroaril-*N*-alquil C₁-C₆-amino o *N*-heteroaril-alquil C₁-C₆-*N*-alquil C₁-C₆-amino, en el que todos estos sustituyentes están opcionalmente sustituidos;

25 en la que, cuando G es un grupo protector, entonces G se selecciona de los grupos fenil-alquilo de C₁-C₈ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alqui C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfonilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₈ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfonilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquenilo de C₃-C₈, haloalquenilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g y CH₂-X^f-R^h;

en los que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son, independientemente entre sí, oxígeno o azufre; y en los que

35 R^a es H, alquilo de C₁-C₁₈, alquenilo de C₂-C₁₈, alquinilo de C₂-C₁₈, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxialquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo de C₁-C₅, *N*-alquil C₁-C₅-carbonil-*N*-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfonilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅, (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfonilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

50 R^b es alquilo de C₁-C₁₈, alquenilo de C₃-C₁₈, alquinilo de C₃-C₁₈, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquilo C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo de C₁-C₅, *N*-alquil C₁-C₅-carbonil-*N*-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el

C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; difenilamino, o difenilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o cicloalquil C₃-C₇-amino, di-cicloalquil C₃-C₇-amino o cicloalcoxi de C₃-C₇, haloalcoxi de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino o dialquil C₂-C₈-amino, benciloxi o fenoxi, en el que los grupos bencilo y fenilo pueden a su vez estar sustituidos con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

R^h es alquilo de C₁-C₁₀, alquenilo de C₃-C₁₀, alquinilo de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alqueinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo de C₁-C₅, *N*-alquil C₁-C₅-carbonil-*N*-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxi-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo, o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro;

y en la que, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto de alquilo, solo o como parte de un grupo más grande, se seleccionan de uno o más halógeno, nitro, ciano, cicloalquilo de C₃-7 (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-6 o halógeno), cicloalquenilo de C₅-7 (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-6 o halógeno), hidroxil, alcoxi de C₁-10, alcoxi C₁-10-alcoxi (C₁-10), tri-alquil (C₁-4)-silil-alcoxi (C₁-6), alcoxi C₁-6-carbonil-alcoxi (C₁-10), haloalcoxi de C₁-10, aril-alcoxi (C₁-4) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-7-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-6 o halógeno), alquenil C₃-10-oxi, alquinil C₃-10-oxi, mercapto, alquil C₁-10-tio, haloalquil C₁-10-tio, arilalquil (C₁-4)-tio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-7-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-6 o halógeno), tri-alquil (C₁-4)-silil-alquil (C₁-6)-tio, ariltio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁-6-sulfonilo, haloalquil C₁-6-sulfonilo, alquil C₁-6-sulfinilo, haloalquil C₁-6-sulfinilo, arilsulfonilo (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido), trialquil (C₁-4)-sililo, arildi-alquil (C₁-4)-sililo, alquil (C₁-4)-diarilsililo, triarilsililo, aril-alquil (C₁-4)-tio-alquilo (C₁-4), ariloxi-alquilo (C₁-4), formilo, alquil C₁-10-carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁-10-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-6-aminocarbonilo, di(alquil C₁-6)aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-3)-*N*-(alcoxi C₁-3)aminocarbonilo, alquil C₁-6-carboniloxi, arilcarboniloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil (C₁-6)-aminocarboniloxi, alquil C₁-6-imino-oxi, alquenil C₃-6-oxi-imino, ariloxiimino, arilo (él mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-6 o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterocicliloxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-6 o halógeno), amino, alquil C₁-6-amino, di-alquil (C₁-6)amino, alquil C₁-6-carbonilamino, *N*-alquil (C₁-6)-carbonil-*N*-alquil (C₁-6)-amino, alquenil C₂-6-carbonilo, alquinil C₂-6-carbonilo, alquenil C₃-6-oxicarbonilo, alquinil C₃-6-oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido);

y en la que, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo se seleccionan de aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquílico;

y en la que, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo se seleccionan de alquilo de C₁-3 y aquellos sustituyentes opcionales definidos anteriormente para un resto alquílico;

5 y en la que, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclos se seleccionan, independientemente, de: halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), alquenilo de C₂₋₆, haloalquenilo de C₂₋₆, alquino de C₂₋₆, cicloalquilo de C₃₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), cicloalquenilo de C₅₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁₋₁₀, alcoxilo, alcoxilo C₁₋₁₀-alcoxilo (C₁₋₁₀), tri-alquil (C₁₋₄)-silil-alcoxi (C₁₋₆), alcoxi C₁₋₆-carbonil-alcoxi (C₁₋₁₀), haloalcoxi de C₁₋₁₀, aril-alcoxi (C₁₋₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁₋₆), cicloalquil C₃₋₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), alqueno C₃₋₁₀-oxi, alqueno C₃₋₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁₋₁₀-tio, haloalquil C₁₋₁₀-tio, aril-alquil (C₁₋₄)-tio, cicloalquil C₃₋₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), trialquil (C₁₋₄)-silil-alquil (C₁₋₆)-tio, ariltio, alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, arilsulfonilo, tri-alquil (C₁₋₄)-sililo, arildi-alquil (C₁₋₄)-sililo, alquil (C₁₋₄)-diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁₋₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁₋₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁₋₆)-aminocarbonilo, N-(alquil C₁₋₃)-N-(alcoxi C₁₋₃)aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil (C₁₋₆)-amino-carboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heterocicli (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), heterociclioxi (en el que el grupo heterocicli está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), amino, alquil C₁₋₆-amino, di-alquil (C₁₋₆)-amino, alquil C₁₋₆-carbonilamino, N-alquil (C₁₋₆)-carbonil-N-alquil (C₁₋₆)-amino, y arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁₋₆); o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁₋₆;

25 y en la que, para grupos heterocicli sustituidos, entonces el uno o más sustituyentes se seleccionan independientemente de halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-tio, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, nitro y ciano;

y en la que "heterocicli" significa un sistema anular no aromático monocíclico o bicíclico que contiene hasta 7 átomos que incluyen uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N;

y en la que "arilo" significa fenilo;

30 y en la que "heteroarilo" significa un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o en dos anillos condensados.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido o un grupo COR¹³, CO₂R¹⁴ o CONR¹⁵R¹⁶, CR¹⁷=NOR¹⁸ o CR¹⁹=NNR²⁰R²¹, en los que

35 R¹³, R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ son alquilo de C₁₋₆,

R¹⁷ y R¹⁹ son hidrógeno o alquilo de C₁₋₃,

R¹⁸ es alquilo de C₁₋₃, y

R²⁰ y R²¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo de C₁₋₃.

40 3. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que R⁶ y R¹¹ son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo o metilo sustituido con alcoxi de C₁₋₃.

4. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, independientemente entre sí, hidrógeno, ciano, alquilo de C₁₋₆, alquenilo de C₂₋₆, alcoxi de C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-tio-alquilo de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfinil-alquilo de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonil-alquilo de C₁₋₆, heterocicli de 3 a 7 miembros, fenilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o CR^{17A}=NOR^{18A}, en el que

45 R^{17A} es hidrógeno o alquilo de C₁₋₃, y

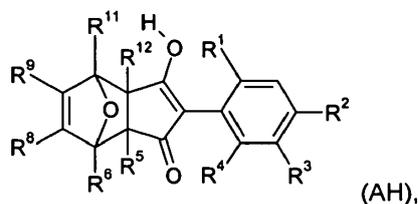
R^{18A} es alquilo de C₁₋₃.

5. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que uno de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ es un arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido.

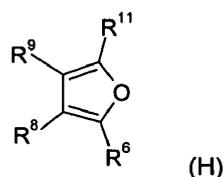
50 6. Un compuesto según la reivindicación 5, en el que uno de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ es fenilo, furilo, tienilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo, opcionalmente sustituido.

7. Un compuesto según la reivindicación 6, en el que uno de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ es piridilo o piridilo sustituido con trifluorometilo o halógeno.

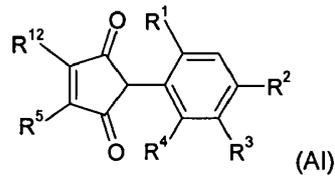
8. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son hidrógeno.
9. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que R^7 y R^{10} forman un enlace.
10. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, ciano, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_6 , heterociclilo de 3 a 7 miembros, fenilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.
11. Un compuesto según la reivindicación 10, en el que R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, o fenilo opcionalmente sustituido.
12. Un compuesto según la reivindicación 10, en el que uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} es heteroarilo opcionalmente sustituido.
13. Un compuesto según la reivindicación 12, en el que uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} es furilo, tienilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo, opcionalmente sustituido.
14. Un compuesto según la reivindicación 13, en el que uno de R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} es piridilo sustituido una o dos veces con trifluorometilo o halógeno.
15. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno.
16. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno, y R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, independientemente entre sí, hidrógeno, ciano, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_6 , heterociclilo de 3 a 7 miembros, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.
17. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^5 y R^{12} son, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo de C_1-C_3 .
18. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 es metilo, etilo, vinilo, etinilo, ciclopropilo, difluorometoxi, trifluorometoxi o alcoxi de C_1-C_2 , y R^2 , R^3 y R^4 son, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, vinilo o etinilo.
19. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que, cuando G es un grupo protector, entonces G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, y los significados de X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se definen en la reivindicación 1.
20. Un compuesto según la reivindicación 1, 2 ó 10, en el que G es hidrógeno, un metal alcalino o un metal alcalino-térreo.
21. Un compuesto según la reivindicación 20, en el que G es hidrógeno.
22. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (AH)



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^8 , R^9 , R^{11} y R^{12} son como se definen en la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (H)



- 35 con un compuesto de fórmula (AI)



en presencia o ausencia de un catalizador, y en presencia o ausencia de un disolvente.

5

23. Una composición herbicida que, además de comprender adyuvantes de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21.

24. Una composición herbicida según la reivindicación 23, que, además de comprender adyuvantes de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz del compuesto de fórmula I y un herbicida adicional.

10

25. Una composición herbicida según la reivindicación 23, que, además de comprender adyuvantes de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz del compuesto de fórmula I, un herbicida adicional y un protector.

26. Un método para controlar hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, o de una composición que comprende tal compuesto, a las plantas o a su locus.

15

27. Un método para controlar hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles según la reivindicación 26, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente eficaz de la composición que comprende el compuesto a las plantas o a su locus;

y en el que los cultivos de plantas útiles son trigo, cebada, maíz, colza, remolacha, caña de azúcar, haba de soja, algodón, girasol, o cacahuete.