

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 539 517**

51 Int. Cl.:

C07D 213/82 (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01)
C07D 413/06 (2006.01)
C07D 417/06 (2006.01)
C07D 211/76 (2006.01)
A01N 25/32 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.04.2008 E 08735266 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.04.2015 EP 2144879**

54 Título: **Piridonacarboxamidas, agentes protectores de plantas útiles que contienen las mismas y procedimiento para su preparación y su uso**

30 Prioridad:

30.04.2007 EP 07400013

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

01.07.2015

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**ZIEMER, FRANK;
WILLMS, LOTHAR;
ROSINGER, CHRISTOPHER H.;
AULER, THOMAS;
HACKER, ERWIN y
BICKERS, UDO**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 539 517 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

Piridonacarboxamidas, agentes protectores de plantas útiles que contienen las mismas y procedimiento para su preparación y su uso

5 La presente invención representa compuestos y agentes protectores de plantas útiles que contienen compuestos especiales como protectores (*safener*) para la reducción de efectos fitotóxicos de compuestos agroquímicos, en particular de herbicidas. En particular, la invención representa derivados de piridona como protectores y a procedimientos para su preparación.

10 Al combatir organismos indeseados en cultivos de plantas útiles de la agricultura y la silvicultura con pesticidas, con frecuencia también se dañan con más o menos intensidad las plantas útiles por los pesticidas usados. Este efecto secundario fitotóxico indeseado aparece en un grado particular en el caso del uso de numerosos herbicidas, y allí, en primera línea, en el caso de la aplicación en la postemergencia, en cultivos de plantas útiles tales como, por ejemplo, maíz, arroz o cereales. Mediante el empleo de los denominados "protectores" o "antídotos", en algunos casos se pueden proteger las plantas útiles contra las propiedades fitotóxicas de los pesticidas sin que se merme o perjudique sustancialmente el efecto pesticida frente a los organismos perjudiciales. En algunos casos incluso se ha observado un efecto pesticida mejorado contra organismos perjudiciales tales como malas hierbas.

15 Los compuestos que se han dado a conocer hasta ahora como protectores pertenecen a un gran número de diferentes clases estructurales químicas, dependiendo su idoneidad para la aplicación protectora, por norma general, también de las estructuras químicas de los pesticidas y de los cultivos de plantas útiles.

20 Desde hace tiempo se conocen efectos de protectores de compuestos del grupo de los derivados de ácidos fenoxi o heteroariloxialcanocarboxílicos, cuando estos compuestos se aplican en combinación con herbicidas. Son ejemplos de tales compuestos MCPA y compuestos similares que, al mismo tiempo, todavía tienen efecto herbicida contra plantas perjudiciales, o cloquintocet-mexilo. Además son conocidos protectores del grupo de los derivados de ésteres de ácido carboxílico de compuesto heteroaromático sustituidos con N-fenilo con varios heteroátomos en el heterociclo. Son ejemplos de tales protectores los protectores usados en productos comerciales mefenpir-dietilo e isoxadifeno-etilo. Por el documento WO 2004/084631 es conocido el uso de derivados de ácidos carboxílicos aromáticos sustituidos con hidroxilo. En el documento WO 2005/015994 se han descrito en especial derivados del ácido salicílico como protectores. Estos son particularmente adecuados para la aplicación como protectores en cultivos de maíz y soja. Además, por el documento WO 2005/112630 son conocidos derivados de 1,2-dihidroquinoxalin-2-ona como protectores.

30 Por la bibliografía se conocen principios activos de la clase química de las piridonas con propiedades pesticidas. Se describen diferentes efectos biológicos; de este modo, por ejemplo, en el documento WO 2001/014339 se menciona el efecto fungicida de determinadas piridonacarboxamidas sustituidas, los documentos WO 2005/042492 y WO 2005/042493 describen, entre otras cosas, el efecto fungicida de heterociclicarboxanilidas. El documento EP-A-544151 describe el efecto de piridonacarboxamidas sustituidas con hidroxilo como herbicidas. Además son conocidos significantes con propiedades farmacológicas. De este modo, en el documento WO 2001/055115 se describen nicotinanilidas como inductores de la apoptosis y en el documento US 2004/0116479, dialquilnicotinamidas como inhibidores de la angiogénesis.

35 Además, el documento EP-A-522392 describe piridonacarboxamidas sustituidas con 6-trifluorometilo como precursores para la síntesis de sulfonilureas de efecto herbicida. En Helv. Chim. Acta 71 (1988) 596-601 y en el documento GB 2305174 se mencionan 1,2-dihidro-2-oxo-6-trifluorometilpiridin-3-carboxamida, 6-cloro(difluoro)metil-1,2-dihidro-2-oxo-piridin-3-carboxamida así como 6-difluorometil-1,2-dihidro-2-oxo-piridin-3-carboxamida como productos intermedios en la síntesis de piranopiridinas. En el documento WO 2007/041052 se menciona 1,2-dihidro-2-oxo-6-trifluorometilpiridin-3-carboxamida como producto intermedio en la síntesis de espiropiperidinas de efecto farmacológico.

45 Todavía no es conocido un uso de tales compuestos como protectores en combinación con determinados pesticidas.

El documento WO 2006/007981 describe un procedimiento para hallar compuestos que induzcan la defensa frente a patógenos de plantas, valorándose el aumento de la expresión de genes endógenos de plantas como un índice de la inducción. A este respecto se menciona 1,2-dihidro-2-oxo-6-trifluorometilpiridin-3-carboxamida dentro de un grupo de seis compuestos que se denominan protectores. Hasta ahora no se ha conocido un efecto de protector demostrado mediante ensayos biológicos en plantas para este compuesto y tampoco se desvela de forma suficiente por el documento WO 2006/007981.

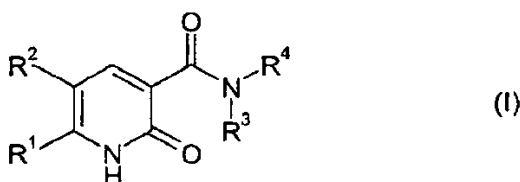
50 En particular los valores de expresión que se han obtenido de acuerdo con el documento WO 2006/007981 con el compuesto y que, en parte, se encuentran en un nivel claramente menor que para protectores disponibles en el mercado así mismo mencionados, en todo caso dejan esperar que son claramente menos adecuados, si es que los son, como protectores.

En el caso de la aplicación de protectores para la protección de plantas útiles frente a daños de pesticidas se ha mostrado que los protectores conocidos pueden presentar desventajas en muchos casos. A esto pertenecen:

- el protector disminuye el efecto de los pesticidas, en particular el de herbicidas, contra las plantas perjudiciales,
 - las propiedades protectoras de plantas útiles no son suficientes,
 - en combinación con un determinado herbicida, el espectro de las plantas útiles en las que se debe realizar el empleo de protector/herbicida no es suficientemente grande,
- 5
- un determinado protector se puede combinar solo con pocos herbicidas,
 - el uso de protectores aumenta la cantidad de aplicación que se tiene que aplicar y la cantidad de formulación y, por tanto, puede causar problemas en cuanto a la técnica de aplicación.

Por lo motivos mencionados existe una necesidad de facilitar compuestos alternativos con efecto protector.

El objetivo de la invención es el uso de compuestos de fórmula (I), o sus sales



- 10 en la que
- R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆), preferentemente un resto de la fórmula CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F y
- R² significa hidrógeno o halógeno y
- 15 R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₆), alquenilo (C₂-C₁₆) o alquinilo (C₂-C₁₆),
- estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituidos o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆), que está no sustituido o sustituido, fenilo, que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,
- 20 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros, o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
- estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆), que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,
- 25 y
- 30 R⁴ significa alquilo (C₁-C₁₆), alquenilo (C₂-C₁₆) o alquinilo (C₂-C₁₆),
- estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,
- 35 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
- estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,
- 40

o

R³ significa alcoxi (C₁-C₄), alqueniiloxi (C₂-C₄), alquiniiloxi (C₂-C₆) o haloalcoxi (C₂-C₄) y

R⁴ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄) o

5 R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significa un anillo heterocíclico de cuatro a ocho miembros que, aparte del átomo de N, puede contener también otros heteroátomos de anillo, preferentemente hasta dos heteroátomos de anillo adicionales del grupo N, O y S y que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, ciano, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquilio (C₁-C₄) o

R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significa el grupo

-N=CR⁵-NR⁶R⁷, en el que

10 R⁵ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆), siendo preferentemente hidrógeno y

R⁶, R⁷ representan, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), preferentemente alquilo (C₁-C₂) o R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido directamente forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros, preferentemente saturado, tal como, por ejemplo, piperidinilo, pirrolidinilo o morfolinilo,

o

15 R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆), preferentemente un resto de la fórmula CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, más preferentemente un resto de la fórmula CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, en particular CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, aún más preferentemente CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl o CF₂CF₂CF₃,

20 R² significa halógeno,

R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno

o

25 R¹ significa un resto de la fórmula CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, más preferentemente CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, aún más preferentemente CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl o CF₂CF₂CF₃,

R² significa hidrógeno,

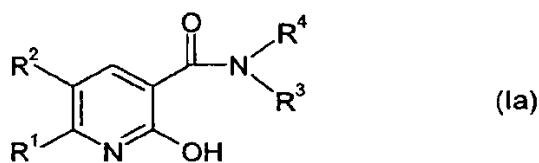
R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno,

30 como agente protector de plantas útiles para la reducción o la evitación de efectos perjudiciales de productos agroquímicos, preferentemente pesticidas, en particular herbicidas, en las plantas útiles.

En lo sucesivo, los compuestos de fórmula (I) y sus sales en algunos casos se denominan también de forma abreviada "compuestos (I)" usados de acuerdo con la invención o de acuerdo con la invención.

35 Los compuestos de fórmula (I) también comprenden tautómeros que pueden formar mediante desplazamiento de hidrógeno y que estructuralmente de manera formal no se incluyen en la fórmula (I). Igualmente, se considera que estos tautómeros están comprendidos por la definición de los compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I). En particular, la definición de los compuestos de la fórmula (I) comprende las estructuras tautoméricas de la fórmula (Ia) (2-hidroxi-piridin-3-carboxamidas) o sus sales



40 en la que

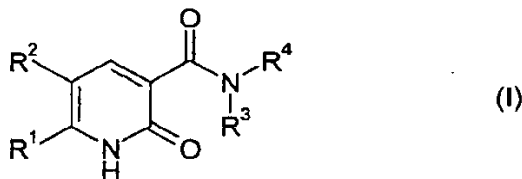
R¹, R², R³ y R⁴ están definidos como en la fórmula (I).

Algunos compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) o sus sales son nuevos y también son objeto de la invención.

También son objeto de la invención agentes protectores de plantas útiles que contienen compuestos de fórmula (I) o sus sales y coadyuvantes de formulación. También son objeto de la invención agentes protectores de plantas útiles que contienen compuestos de fórmula (I) o sus sales en combinación con otros productos agroquímicos, preferentemente pesticidas, en particular herbicidas y dado el caso coadyuvantes de formulación.

5 Algunos compuestos de fórmula (I) ya se han descrito como productos intermedios para la preparación de principios activos; véase el documento ya mencionado GB-A-2305174 (Comp. (I), en el que $R^1 = CF_3$, CF_2Cl o CF_2H y $R^3 = R^4 = H$). En el documento ya mencionado EP-A-522392 se han descrito de forma general, entre otras cosas, compuestos (I) como productos intermedios para la preparación de sulfonilureas. Los efectos protectores de los compuestos no se han descrito.

10 También son objeto de la invención compuestos de fórmula (I) o sus sales



en la que

15 R^1 significa un resto haloalquilo (C_1-C_6), preferentemente un resto de la fórmula CF_3 , CF_2Cl , CF_2H , CF_2CF_3 , CF_2CF_2H , CF_2CF_2Cl , $CFCICF_3$, $CFHCF_3$, $CF(CF_3)_2$, $CH(CF_3)_2$, $CF_2CF_2CF_3$ o $C(CH_3)_2F$, en particular un resto de la fórmula CF_3 , CF_2Cl , CF_2H , CF_2CF_3 , CF_2CF_2H , CF_2CF_2Cl , $CF_2CF_2CF_3$ o $C(CH_3)_2F$, más preferentemente CF_3 , CF_2Cl , CF_2H , CF_2CF_3 , CF_2CF_2H , CF_2CF_2Cl o $CF_2CF_2CF_3$ y

R^2 significa hidrógeno o halógeno y

R^3 significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_{16}), alquínilo (C_2-C_{16}) o alquinilo (C_2-C_{16}),

20 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquil-(C_1-C_4)-amino, di[alquil (C_1-C_4)]-amino, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo y [haloalcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo,

o cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquénilo (C_4-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros, o cicloalquénilo (C_4-C_6) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

25 estando cada uno de los 4 restos mencionado en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquil-(C_1-C_4)-amino, di[alquil (C_1-C_4)]-amino, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [haloalcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), que está no sustituido o sustituido, fenilo, que está no sustituido o sustituido y heterociclilo, que está no sustituido o sustituido,

30 y

R^4 significa alquilo (C_1-C_{16}), alquénilo (C_2-C_{16}) o alquínilo (C_2-C_{16}),

estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquil-(C_1-C_4)-amino, di[alquil (C_1-C_4)]-amino, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo y [haloalcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo,

35 o cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquénilo (C_4-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalquénilo (C_4-C_6) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

40 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquil-(C_1-C_4)-amino, di[alquil (C_1-C_4)]-amino, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [haloalcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo,

cicloalquilo (C_3-C_6) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,

o

45 R^3 significa alcoxi (C_1-C_4), alquénilo (C_2-C_4), alquínulo (C_2-C_6) o haloalcoxi (C_2-C_4) y

- R⁴ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄) o
- R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significa un anillo heterocíclico de cuatro a ocho miembros que, aparte del átomo de N, también puede contener otros heteroátomos de anillo, preferentemente hasta dos heteroátomos de anillo adicionales del grupo N, O y S y que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, ciano, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquilitio (C₁-C₄) o
- 5 R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significa el grupo
-N=CR⁵-NR⁶R⁷, en el que
R⁵ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆), prefiriéndose hidrógeno y
10 R⁶, R⁷ representan, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), preferentemente alquilo (C₁-C₂) o R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido directamente forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros, preferentemente saturado, tal como, por ejemplo, piperidinilo, pirrolidinilo o morfolinilo,
o
- 15 R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆), preferentemente un resto de la fórmula CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, más preferentemente CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, en particular CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, aún más preferentemente CF₂Cl, CF₂CF₃, CF₂CF₂Cl o CF₂CF₂CF₃,
- R² significa halógeno,
- 20 R³ significa hidrógeno y
R⁴ significa hidrógeno
o
- 25 R¹ significa un resto de la fórmula CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, preferentemente CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F, en particular CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃ o CF₂CF₂CF₃, aún más preferentemente CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl o CF₂CF₂CF₃,
- R² significa hidrógeno,
R³ significa hidrógeno y
R⁴ significa hidrógeno.
- 30 Preferentemente a este respecto se exceptúan compuestos de fórmula (I) o sus sales en la que
R¹ significa alquilo (C₁-C₃) que está sustituido con uno a tres átomos de flúor,
R² significa hidrógeno,
R³ significa alquilo (C₁-C₂) y
R⁴ significa alquilo (C₁-C₂).
- 35 Los compuestos preferentemente exceptuados que se han mencionado en último lugar están descritos de forma general en el documento mencionado EP-A-0522392 como productos intermedios para la preparación de sulfonilureas.
- Los compuestos de la fórmula general (I) pueden estar presentes, en función del tipo y la forma de enlace de los sustituyentes como estereoisómeros. Los posibles estereoisómeros definidos por su forma espacial específica tales como enantiómeros, diasterómeros, isómeros Z y E están todos comprendidos por la fórmula (I). Si están presentes, por ejemplo, uno o varios grupos alquenoilo, entonces pueden aparecer diasterómeros (isómeros Z y E). Si están presentes, por ejemplo, uno o varios átomos de carbono asimétricos, entonces pueden aparecer enantiómeros y diasterómeros. Se pueden obtener estereoisómeros a partir de las mezclas que se producen durante la preparación según procedimientos de separación habituales, por ejemplo, mediante procedimientos de separación cromatográficos. Así mismo se pueden preparar selectivamente estereoisómeros mediante el empleo de reacciones estereoselectivas mediante el uso de sustancias de partida y/o coadyuvantes ópticamente activos. Por tanto, la invención se refiere también a todos los estereoisómeros que están comprendidos en la fórmula general (I), sin embargo, que no están indicados con su estereoforma específica, y sus mezclas.
- 45

Las posibilidades de combinación de los distintos sustituyentes de la fórmula general (I) se han de entender de tal manera que se tienen que tener en cuenta los fundamentos generales de la estructura de compuestos químicos, es decir, la fórmula (I) no comprende compuestos de los cuales el experto sabe que químicamente no son posibles.

5 Las denominaciones que se han usado anteriormente y que se usan más adelante son habituales para el experto y tienen, en particular, los significados explicados a continuación:

La expresión "alquilo (C₁-C₄)" indica una notación abreviada para un alquilo de cadena abierta con uno a 4 átomos de carbono de forma correspondiente a la indicación de intervalos para átomos de C, es decir, comprende los restos metilo, etilo, 1-propilo, 2-propilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o *terc*-butilo. Los restos alquilo generales con un mayor intervalo indicado de átomos de C, por ejemplo, "alquilo (C₁-C₆)" comprenden correspondientemente también 10 restos alquilo de cadena lineal o ramificados con un mayor número de átomos de C, es decir, de acuerdo con el ejemplo también los restos alquilo con 5 y 6 átomos de C. Cuando no se indica de forma especial, en los restos hidrocarburo tales como restos alquilo, alqueno y alquino, también en restos compuestos, se prefieren los armazones de carbono inferiores, por ejemplo, con 1 a 6 átomos de C o en caso de grupos insaturados con 2 a 6 átomos de C. Los restos alquilo, también en los significados compuestos tales como alcoxi, haloalquilo, etc. 15 significan, por ejemplo, metilo, etilo, *n*- o *i*-propilo, *n*-, *i*-, *t*- o 2-butilo, pentilos, hexilos, tales como *n*-hexilo, *i*-hexilo y 1,3-dimetilbutilo, heptilos, tales como *n*-heptilo, 1-metilhexilo y 1,4-dimetilpentilo; los restos alqueno y alquino tienen el significado de los posibles restos insaturados correspondientes a los restos alquilo; alqueno significa, por ejemplo, vinilo, alilo, 1-metil-2-propeno, 2-metil-2-propeno, 2-butenilo, penteno, 2-metilpenteno o hexeno, preferentemente alilo, 1-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metil-prop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metil-but-3-en-1-ilo o 1-metil-but-2-en-1-ilo. Alquino (C₂-C₆) significa, por ejemplo, etino, propargilo, 1-metil-2-propino, 2-metil-2-propino, 2-butenilo, 2-pentino o 2-hexino, preferentemente propargilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo o 1-metil-but-3-in-1-ilo. 20

Alquilideno, por ejemplo, también en la forma de alquilideno (C₁-C₁₀), significa resto de un alcano de cadena lineal o ramificado que está unido a través de un doble enlace, no estando establecida todavía la posición del sitio de 25 enlace. En el caso de un alcano ramificado se consideran de forma natural solo posiciones en las que se pueden sustituir dos átomos de H por el doble enlace; son restos, por ejemplo, =CH₂, =CH-CH₃, =C(CH₃)-CH₃, =C(CH₃)-C₂H₅ o =C(C₂H₅)-C₂H₅.

Cicloalquilo significa un sistema de anillo saturado carbocíclico con preferentemente 3-8 átomos de C, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo. En el caso de cicloalquilo sustituido están comprendidos sistemas 30 cíclicos con sustituyentes, estando comprendidos también sustituyentes con un doble enlace en el resto cicloalquilo, por ejemplo, un grupo alquilideno tal como metilideno. En el caso de cicloalquilo sustituido están comprendidos también sistemas alifáticos policíclicos tales como, por ejemplo, biciclo[1.1.0]butan-1-ilo, biciclo[1.1.0]butan-2-ilo, biciclo[2.1.0]pentan-1-ilo, biciclo[2.1.0]pentan-2-ilo, biciclo[2.1.0]pentan-5-ilo, adamantan-1-ilo y adamantan-2-ilo.

Cicloalqueno significa un sistema de anillo carbocíclico, no aromático, parcialmente insaturado con preferentemente 4-8 átomos de C, por ejemplo, 1-ciclobutenilo, 2-ciclobutenilo, 1-ciclopenteno, 2-ciclopenteno, 3-ciclopenteno, o 1-ciclohexeno, 2-ciclohexeno, 3-ciclohexeno, 1,3-ciclohexadieno o 1,4-ciclohexadieno. En el caso de cicloalqueno sustituido se aplican correspondientemente las explicaciones para cicloalquilo sustituido. 35

La denominación "halógeno" significa, por ejemplo, flúor, cloro, bromo o yodo. Haloalquilo, haloalqueno y haloalquino significan alquilo, alqueno o alquino parcial o complemente sustituido con átomos de halógeno 40 iguales o distintos, preferentemente del grupo flúor, cloro y bromo, en particular del grupo flúor y cloro, por ejemplo, monohaloalquilo (= monohalógenoalquilo) tales como CH₂CH₂Cl, CH₂CH₂F, CH₂ClCH₃, CH₂FCH₃, CH₂Cl, CH₂F; perhaloalquilo tales como CCl₃ o CF₃ o CF₃CF₂; polihaloalquilo tal como CHF₂, CH₂F, CH₂FCHCl, CHCl₂, CF₂CF₂H, CH₂CF₃, CH₂CICH₃, CH₂FCH₃; haloalcoxi es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ y OCH₂CH₂Cl; lo correspondiente se aplica a haloalqueno y otros restos sustituidos por halógeno.

45 Cuando un cuerpo de base está sustituido "por uno o varios restos" de una enumeración de restos (= grupo) o un grupo definido genéricamente de restos, entonces esto incluye respectivamente la sustitución simultánea por varios restos iguales y/o estructuralmente diferentes.

Los restos sustituidos, tales como un resto alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalqueno, fenilo, bencilo, heterociclilo y heteroarilo sustituido, significan por ejemplo un resto sustituido derivado del cuerpo de base no 50 sustituido, significando los sustituyentes, por ejemplo, uno o varios, preferentemente 1, 2 o 3 restos del grupo halógeno, alcoxi, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, azido, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamilo, mono- y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido, tal como acilamino, mono- y dialquilamino, trialkilsililo y cicloalquilo dado el caso sustituido, fenilo dado el caso sustituido, heterociclilo dado el caso sustituido, pudiendo estar unido cada uno de los grupos cíclicos mencionados en último lugar también a través de heteroátomos o grupos 55 funcionales divalentes tal como en los restos alquilo mencionados y alquilsulfino, alquilsulfonilo y, en el caso de restos cíclicos (= "cuerpo de base cíclico"), también alquilo, haloalquilo, alquiltio-alquilo, alcoxi-alquilo, mono- y dialquil-aminoalquilo dado el caso sustituido e hidroxilo-alquilo; en la expresión "restos sustituidos" tales como alquilo sustituido, etc., como sustituyentes adicionalmente a los restos que contienen hidrocarburo saturados mencionados están incluidos restos alifáticos y aromáticos insaturados correspondientes tales como alqueno dado el caso

sustituido, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, fenilo, fenoxi, etc. En el caso de restos cíclico sustituidos con partes alifáticas en el anillo están comprendidos también sistemas cíclicos con sustituyentes que están unidos con un doble enlace al anillo, por ejemplo, con un grupo alquilideno tal como metilideno o etilideno o un grupo oxo, grupo imino o grupo imino sustituido.

- 5 Los sustituyentes mencionados a modo de ejemplo ("primer plano de sustituyentes"), siempre que contengan partes que contienen hidrocarburo, allí pueden estar dado el caso sustituidos de forma adicional ("segundo plano de sustituyentes"), por ejemplo, por uno de los sustituyentes tal como se ha definido para el primer plano de sustituyentes. Son posibles correspondientes planos de sustituyentes adicionales. Preferentemente, la expresión "resto sustituido" comprende solo uno o dos planos de sustituyentes.
- 10 Son sustituyentes preferentes para los planos de sustituyentes, por ejemplo, amino, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, mercapto, carboxi, carbonamida, SF₅, aminosulfonilo, alquilo, cicloalquilo, alquenilo, cicloalquenilo, alquinilo, monoalquil-amino, dialquil-amino, *N*-alcanoil-amino, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, cicloalcoxi, cicloalqueniloxi, alcoxi-carbonilo, alqueniloxi-carbonilo, alquiniloxi-carbonilo, ariloxi-carbonilo, alcanoilo, alquenil-carbonilo, alquinil-carbonilo, aril-carbonilo, alquilio, cicloalquilio, alquenilio, cicloalquenilio, alquinilio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, monoalquil-aminosulfonilo, dialquil-aminosulfonilo, *N*-alquil-aminocarbonilo, *N,N*-dialquilaminocarbonilo, *N*-alcanoil-amino-carbonilo, *N*-alcanoil-*N*-alquil-aminocarbonilo, arilo, ariloxi, bencilo, benciloxi, bencilio, arilto, arilamino, bencilamino, heterociclilo y trialquilililo.

- En restos con átomos de C se prefieren aquellos con 1 a 6 átomos de C, preferentemente de 1 a 4 átomos de C, en particular 1 o 2 átomos de C. Por norma general se prefieren sustituyentes del grupo halógeno, por ejemplo, flúor y cloro, alquilo (C₁-C₄), preferentemente metilo o etilo, haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente trifluorometilo, alcoxi (C₁-C₄), preferentemente metoxi o etoxi, haloalcoxi (C₁-C₄), nitro y ciano. A este respecto se prefieren en particular los sustituyentes metilo, metoxi, flúor y cloro.
- 20

- Amino sustituido, tal como amino mono- o disustituido, significa un resto del grupo de los restos amino sustituidos que están N sustituidos, por ejemplo, por uno o dos restos iguales o distintos del grupo alquilo, alcoxi, acilo y arilo; preferentemente mono- y dialquil-amino, mono- y diarilamino, acilamino, *N*-aquil-*N*-arilamino, *N*-alquil-*N*-acilamino así como *N*-heterociclos saturados; a este respecto se prefieren restos alquilo con 1 a 4 átomos de C; a este respecto, arilo preferentemente es fenilo o fenilo sustituido; para acilo a este respecto se aplica la definición mencionada más adelante, preferentemente alcanoilo (C₁-C₄). Lo correspondiente se aplica a hidroxilamino sustituido o hidrazino. Amino sustituido incluye también compuestos de amonio cuaternario (sales) con cuatro sustituyentes orgánicos en el átomo de nitrógeno.
- 25
- 30

- El fenilo dado el caso sustituido es preferentemente fenilo que está no sustituido o sustituido una o varias veces, preferentemente hasta tres veces por restos iguales o distintos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halogenoalquilo (C₁-C₄), halogenoalcoxi (C₁-C₄) y nitro, por ejemplo, *o*-, *m*- y *p*-tolilo, dimetilfenilos, 2-, 3- y 4-clorfenilo, 2-, 3- y 4-fluorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluorometil- y -triclorometilfenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, *o*-, *m*- y *p*-metoxifenilo.
- 35

- Cicloalquilo dado el caso sustituido es preferentemente cicloalquilo que está no sustituido o sustituido una o varias veces, preferentemente hasta tres veces por restos iguales o distintos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halogenoalquilo (C₁-C₄) y halogenoalcoxi (C₁-C₄), en particular está sustituido con uno o dos restos alquilo (C₁-C₄).

- 40 Heterociclilo dado el caso sustituido es preferentemente heterociclilo que está no sustituido o sustituido una o varias veces, preferentemente hasta tres veces por restos iguales o distintos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halogenoalquilo (C₁-C₄), halogenoalcoxi (C₁-C₄), nitro y oxo, en particular está sustituido una o varias veces por restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halogenoalquilo (C₁-C₄) y oxo, muy en particular por uno o dos restos alquilo (C₁-C₄).

- 45 Acilo significa un resto de un ácido orgánico que se produce de manera formal mediante separación de un grupo hidroxilo en la función ácido, pudiendo estar unido el resto orgánico en el ácido también a través de un heteroátomo con la función ácido. Son ejemplos de acilo el resto -CO-R de un ácido carboxílico HO-CO-R y restos de ácidos derivados de esto tales como ácido tricarbóxico, ácidos iminocarboxílicos dado el caso N sustituidos o el resto de monoésteres de ácido carbónico, ácido carbamínico N-sustituido, ácidos sulfónicos, ácidos sulfínicos, ácidos sulfonamídicos N-sustituidos, ácidos fosfónicos, ácidos fosfínicos.
- 50

- Acilo significa por ejemplo formilo, alquilcarbonilo tal como [alquilo (C₁-C₄)]-carbonilo, fenilcarbonilo, alcocicarbonilo, feniloxicarbonilo, benciloxicarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, *N*-alquil-1-iminoalquilo, *N*-alquil- y *N,N*-dialquilcarbamilo y otros restos de ácidos orgánicos. A este respecto, los restos pueden estar sustituidos de forma adicional respectivamente en la parte de alquilo o fenilo, por ejemplo, en la parte de alquilo por uno o varios restos del grupo halógeno, alcoxi, fenilo y fenoxi; son ejemplos de sustituyentes en la parte de fenilo los sustituyentes que ya se han mencionado anteriormente en general para fenilo sustituido.
- 55

Acilo significa preferentemente un resto acilo en el sentido más estrecho, es decir, un resto de un ácido orgánico en el que el grupo ácido está unido directamente con el átomo de C de un resto orgánico, por ejemplo, alcanoilo, tal

como formilo y acetilo, aroilo tal como fenilcarbonilo y otros restos de ácidos orgánicos saturados o insaturados.

"Aroilo" significa un resto arilo tal como se ha definido anteriormente que está unido a través de un grupo carbonilo, por ejemplo, el grupo benzoilo.

Cuando un resto general está definido con "hidrógeno", esto significa un átomo de hidrógeno.

5 Con la "posición ilo" de un resto se indica su sitio de unión.

De forma correspondiente a las definiciones generales significan:

"alquilo (C₁-C₆)" resto metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o *terc*-butilo;

10 "alquilo (C₁-C₁₀)" comprende según esto los restos alquilo que se han mencionado anteriormente así como restos pentilo isoméricos tales como *n*-pentilo, restos 1,1-dimetilpropilo o 2-metilbutilo, restos hexilo, heptilo, octilo, nonilo o decilo isoméricos;

"alqueno (C₂-C₄)" se refiere según esto, por ejemplo, a vinilo, alilo, 2-metil-2-propen-1-ilo, 2- o 3-buten-1-ilo,

"alqueno (C₃-C₁₀)" se refiere según esto por ejemplo al grupo alilo, 2-metil-2-propen-1-ilo, 2- o 3-buten-1-ilo, pentenilo, 2-metilpentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo o decenilo,

"alquino (C₂-C₄)" se refiere, por ejemplo, al grupo etinilo, propargilo o 2-buten-1-ilo,

15 "alquino (C₃-C₁₀)" se refiere, por ejemplo, al grupo propargilo, 2-buten-1-ilo, 2-pentin-1-ilo, 2-metilpentin-3-ilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo o decinilo.

Si la cadena de carbono de un resto alquilo está interrumpida varias veces por átomos de oxígeno, esto significa que dos átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes.

"Cicloalquilo (C₃-C₆)" represental resto ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo,

20 "cicloalquilo (C₃-C₁₀)" representa restos alquilo monocíclicos tales como el resto ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo o ciclodecilo, a restos alquilo bicíclicos, tales como resto norbornilo o biciclo[2.2.2]octilo o a sistemas condensados tales como el resto decahidronaftilo. "Cicloalqueno (C₄-C₁₀)" representa restos cicloalqueno monocíclicos tales como el resto ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo ciclooctenilo o ciclodecenilo, a restos alquilo bicíclicos tales como el resto norbornenilo o biciclo[2,2,2]octenilo o a sistemas condensados tales como el resto tetra-, hexa- u octahidronaftilo.

25 "Alcoxi (C₁-C₄)" y "alcoxi (C₁-C₁₀)" son grupos alcoxi cuyos restos hidrocarburo tienen los significados indicados en las expresiones "alquilo (C₁-C₄)" y "alquilo (C₁-C₁₀)".

30 Sobre todo por los motivos del mayor efecto protector de plantas útiles o protector de plantas de cultivo (efecto protector), la mejor selectividad y/o la mejor capacidad de producción, son de particular interés usos de acuerdo con la invención de compuestos de la fórmula (I) mencionada o sus sales en los que restos individuales tienen uno de los significados preferentes ya mencionados o mencionados a continuación o en particular aquellos en los que uno o varios de los significados preferentes bien mencionados o mencionados a continuación aparecen de forma combinada.

35 Preferentemente significa, siempre que esté comprendido en el marco de la definición general que se ha mencionado anteriormente de la fórmula (I),

R¹ un resto haloalquilo (C₁-C₄), más preferentemente CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, C(CH₃)₂F o CF₂CF₂CF₃, particularmente CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₂CF₃ o CF₂CF₃, más preferentemente CF₃, CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o CF₂CF₃, en particular CF₃, CF₂Cl o CF₂CF₃.

Preferentemente significa

40 R² hidrógeno o halógeno. A este respecto, halógeno es preferentemente flúor, cloro, bromo o yodo, en particular cloro, bromo o yodo, muy en particular cloro o bromo.

Preferentemente significan

R³ hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),

45 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo

- (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente estando no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),
- fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y
- 5 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo, preferentemente está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄),
- 10 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
- 15 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- 20 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente estando no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),
- fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y
- heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo, preferentemente está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄),
- 25 más preferentemente hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆), estando cada uno de los tres restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y alcoxycarbonilo (C₁-C₄),
- más preferentemente hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), en particular hidrógeno
- y
- 30 R⁴ alquilo (C₁-C₁₀), alquenilo (C₂-C₁₀) o alquinilo (C₂-C₁₀),
- estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- 35 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente estando no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),
- fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y
- heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo, preferentemente está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄),
- 40 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
- 45 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino,
- [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- 50 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo

(C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente estando no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),

fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y

5 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo, preferentemente está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄).

10 A este respecto, heterociclilo significa preferentemente un anillo heterocíclico de 3 a 9 miembros, en particular de 5 o 6 miembros con 1 a 3 heteroátomos de anillo del grupo N, O y S.

Además, preferentemente significan

R³ hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),

15 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente está no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),

20 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y

heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,

o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6,

25 estando cada uno de los 2 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄),

más preferentemente hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆),

estando cada uno de los tres restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y alcoxycarbonilo (C₁-C₄),

30 más preferentemente hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), en particular hidrógeno

y

R⁴ tal como se ha definido ya para R⁴ o preferentemente alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),

35 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente está no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),

40 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y

heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,

o cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

45 estando cada uno de los 2 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄).

Además, preferentemente significan

- R³ hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 preferentemente hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆),
- 5 estando cada uno de los 3 restos mencionado en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 más preferentemente hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), en particular hidrógeno
- y
- R⁴ tal como se ha definido ya anteriormente para R⁴ o preferentemente
- 10 alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 preferentemente alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆),
- 15 estando cada uno de los 3 restos mencionado en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- Es particularmente preferente el uso de acuerdo con la invención con compuestos de fórmula (I) o sus sales, en la que
- R¹ significa CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₂CF₃ o CF₂CF₃, preferentemente CF₃, CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o CF₂CF₃, en particular CF₃, CF₂Cl o CF₂CF₃ y
- 20 R² hidrógeno o halógeno, preferentemente hidrógeno y
- R³ hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 preferentemente hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆),
- 25 estando cada uno de los 3 restos mencionado en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 en particular hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), y
- R⁴ alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₃-C₁₀) o alquino (C₃-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente está no sustituido o sustituido con alquilo (C₁-C₄),
- 30
- 35 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄) y
 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,
- 40 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
 estando cada uno de los 2 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄),
 preferentemente alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios

restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, más preferentemente alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆),

estando cada uno de los 3 restos mencionado en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

5 o

R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente forman un anillo heterocíclico de cuatro a ocho miembros, preferentemente anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros que, aparte del átomo de N, puede contener también otros heteroátomos de anillo, preferentemente hasta dos heteroátomos de anillo adicionales del grupo N, O y S y que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo halógeno, ciano, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄),

10

R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente forman el grupo

-N=CR⁵-NR⁶R⁷, en la que

R⁵ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), siendo preferente hidrógeno y

R⁶, R⁷ representan independientemente entre sí hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), preferentemente alquilo (C₁-C₂) o R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido directamente forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros, preferentemente saturado, tal como, por ejemplo, piperidinilo, pirrolidinilo o morfolinilo.

15

Se prefiere en particular también el uso de acuerdo con la invención con compuestos de Fórmula (I) o sus sales, en la que

20

R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆), preferentemente del grupo CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ y C(CH₃)₂F, más preferentemente CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₂CF₃ o CF₂CF₃, aún más preferentemente CF₃, CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o CF₂CF₃, en particular CF₃, CF₂CF₃ o CF₂Cl y

R² significa halógeno y

R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno.

25

Así mismo particularmente preferente es también el uso de acuerdo con la invención con compuestos de fórmula (I) o sus sales, en la que

R¹ significa CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H o CF₂CF₂Cl, más preferentemente CF₂Cl o CF₂H o CF₂CF₃, más preferentemente CF₂Cl o CF₂CF₃, en particular CF₂Cl

R² significa hidrógeno y

30

R³ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄) y

R⁴ significa hidrógeno.

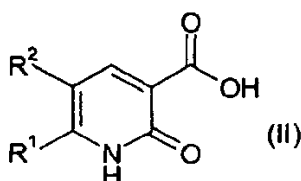
También es particularmente preferente el uso de acuerdo con la invención con compuesto de fórmula (I) o sus sales, en la que los restos generales se corresponden con los restos mencionados en los ejemplos de las tablas para R¹, R², R³ o R⁴ o comprende los mismos.

35

También es particularmente preferente el uso de acuerdo con la invención con nuevos compuestos de fórmula (I) o sus sales, en la que R¹, R², R³ o R⁴ además tienen preferentemente los significados mencionados para los usos preferentes.

Los compuestos de la fórmula general (I) se pueden preparar al hacer reaccionar, por ejemplo

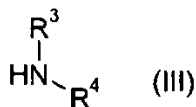
(a) un ácido carboxílico de fórmula general (II)



40

en la que R¹ y R² están definidos como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar,

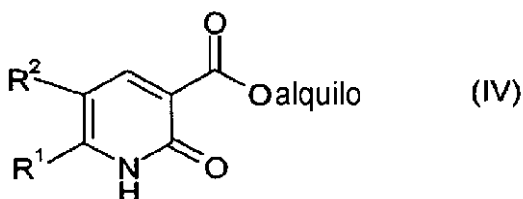
con una amina de fórmula (III) o su sal



en la que R^3 y R^4 están definidos como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar

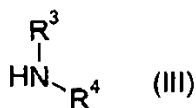
5 dado el caso en presencia de un reactivo activador de ácido carboxílico, por ejemplo, *N,N*-carbonildiimidazol (CDI), o un agente que retira agua, por ejemplo, dicitohexilcarbodiimida (DCC) hasta dar el compuesto de fórmula (I)

(b) al hacer reaccionar un éster de ácido carboxílico de fórmula general (IV)



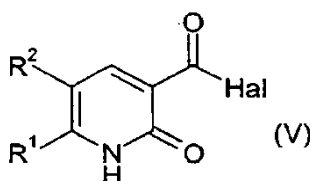
10 en la que R^1 y R^2 están definidos como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar y "alquilo" significa un resto alquilo, por ejemplo, metilo o etilo,

con una amina de fórmula (III) o su sal

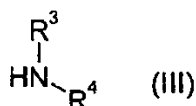


en la que R^3 y R^4 están definidos como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar, hasta dar el compuesto de fórmula (I) o

15 (c) al hacer reaccionar un halogenuro o anhídrido de ácido carboxílico de la fórmula general (V)



en la que R^1 y R^2 están definidos como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar y Hal significa el átomo de halógeno, por ejemplo, cloro o un resto aciloxi, con una amina de fórmula (III) o su sal



20 en la que R^3 y R^4 están definidos como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar, hasta dar el compuesto de fórmula (I),

(d) al hacer reaccionar, en el caso de que R^3 y R^4 en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar represente respectivamente hidrógeno,

un compuesto de fórmula (VI),



25 en la que R^1 está definido como en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar y "alquilo" significa un

resto alquilo, por ejemplo, metilo o etilo, con diamida de ácido malónico hasta dar el compuesto de fórmula (I).

Las formaciones de amida según la variante (a) se pueden llevar a cabo, por ejemplo, en un disolvente orgánico inerte en un intervalo de temperaturas entre 0 °C y 150 °C, preferentemente 0 °C y 50 °C. Como disolventes orgánicos son adecuados, por ejemplo, disolventes próticos o apróticos polares tales como éteres, por ejemplo, éter de dietilo, tetrahidrofurano o dioxano o nitrilos tales como acetonitrilo o amidas tales como dimetilformamida.

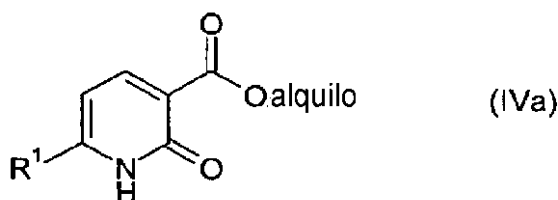
Las formaciones de amida según la variante (b) se pueden llevar a cabo, por ejemplo, en un disolvente orgánico inerte en un intervalo de temperaturas entre 0 °C y 150 °C, preferentemente 50 °C y 100 °C. Como disolventes orgánicos son adecuados, por ejemplo, disolventes próticos o apróticos polares tales como éteres, por ejemplo, tetrahidrofurano y dioxano o nitrilos tales como acetonitrilo o amidas tales como dimetilformamida. Sin embargo se prefiere la formación de amidas según la variante (b) a temperaturas elevadas mediante reacción de los componentes de reacción en sustancia.

Las formaciones de amida según la variante (c) se pueden llevar a cabo, por ejemplo, en presencia de un agente de unión a ácido en un disolvente orgánico inerte en un intervalo de temperaturas entre 0 °C y 150 °C, preferentemente 0 °C y 50 °C. Como disolventes orgánicos son adecuados, por ejemplo, disolventes próticos o apróticos polares tales como éteres, por ejemplo, éter de dietilo, tetrahidrofurano o dioxano o nitrilos tales como acetonitrilo o amidas tales como dimetilformamida. Son agentes de unión a ácido, por ejemplo, carbonatos de metal alcalino o alcalinotérreo tales como, por ejemplo, carbonato de sodio, potasio o calcio, hidróxidos de metal alcalino o alcalinotérreo tales como hidróxido de sodio, potasio o calcio o hidruros o amidas de metal alcalino tales como hidruro o amida de sodio, potasio o también bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, DBU (1,8-diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-en), DBN (1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-en) y 1,4-diaza-bicyclo[2.2.2]octano.

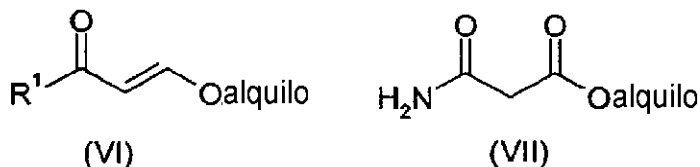
Las formaciones de amida según la variante (d) se pueden llevar a cabo de forma análoga al procedimiento como está descrito en el documento EP 522392 y Helv. Chim. Acta 71 (1988) 596-601 y el documento GB 2305174. La diamida de ácido malónico se puede convertir por norma general en un disolvente prótico o aprótico polar anhidro orgánico, por ejemplo, en un alcohol, con una base fuerte tal como un metal alcalino, hidruro de metal alcalino o alcoholato de metal alcalino en una sal reactiva y entonces hacerse reaccionar con el compuesto de fórmula (VI). La reacción con el compuesto (VI) se puede llevar a cabo por norma general en un intervalo de temperaturas entre 0 °C y el punto de ebullición del disolvente (en función del disolvente aproximadamente hasta 150 °C).

Los compuestos de las fórmulas generales (II), (III), (IV) y (V) están disponibles en el mercado o se pueden preparar según o de forma análoga a procedimientos conocidos por un experto (por ejemplo B. Helv. Chim. Acta 71 (1988) 596; documento EP 502740; documento EP 522392).

De este modo se pueden obtener, por ejemplo, los compuestos de la fórmula (IVa)



mediante reacción de viniléteres de alcoxi de fórmula (VI) con amidas de alquilester de ácido malónico de fórmula (VII).



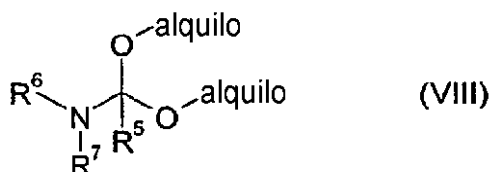
Los reactantes de la fórmula (VI) están disponibles en el mercado o se pueden preparar según procedimientos conocidos (por ejemplo Synthesis 2000, 738-742; J. Fluor. Chem., 107, 2001, 285-300; Organometallics 15, 1996, 5374-5379).

Los compuestos de la fórmula (IV), en la que R² significa un átomo de halógeno, se pueden preparar mediante halogenaciones habituales a partir de los compuestos de la fórmula (IVa). Como agentes de halogenación para piridinas se usan, por ejemplo, cloro (J. Org. Chem. 23, 1958, 1614), bromo (Synth. Commun. 19, 1989, 553-560; documento US P 2532055), yodo (Tetrahedron Lett. 45, 2004, 6633-6636), hipoclorito sódico (J. Org. Chem. 49, 1984, 4784-4786; J. Med. Chem. 36, 1993, 2676-2688, documento US P 4960896), hipodromito sódico (J. Med. Chem. 32, 1989, 2178-2199), cloruro de tionilo (Organic Letters, 6, 2004, 3-5), N-clorosuccinimida (J. Med. Chem.

46, 2003, 702-715), *N*-bromosuccinimida (Chem. Pharm. Bull. 48, 2000, 1847-1853), *N*-yodosuccinimida (J. Med. Chem. 36, 1993, 2676-2788).

Además, los compuestos de la fórmula (IV) se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (IVa) sucesivamente mediante nitración (por ejemplo J. Med. Chem. 36, 1993, 2676-2688; J. Heterocycl. Chem. 33, 1996, 287-294), reducción (por ejemplo J. Med. Chem. 33, 1990, 1859-1865), diazocitación y reacción posterior de las sales de diazonio mediante reacción de Sandmeyer o Schiemann.

Aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significan el grupo -N=CR⁵-NR⁶R⁷ se pueden preparar al hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I), en la que R³ y R⁴ significan hidrógeno, con compuestos de fórmula (VIII), en los que R⁵, R⁶ y R⁷ tienen el significado que se ha mencionado anteriormente,



según procedimientos conocidos (véase, por ejemplo, Synthesis 1980, 119-121; J. Med. Chem., 33, 1990, 2052-2059).

Es un objetivo de la invención también el procedimiento para la protección de plantas de cultivo o útiles frente a los efectos fitotóxicos de productos agroquímicos tales como pesticidas o en particular herbicidas, que causan daños en las plantas de cultivo o útiles, caracterizado porque se aplican compuestos de fórmula (I) o sus sales, protectores, preferentemente se aplica una cantidad eficaz de los compuestos de fórmula (I) o sus sales sobre las plantas, partes de las plantas o sus semillas (o simiente).

Los compuestos (I) (= protectores) son adecuados para emplearse junto con principios activos (pesticidas) para combatir selectivamente organismos perjudiciales en una serie de plantas de cultivo, por ejemplo, en cultivos económicamente importantes tales como cereales (trigo, cebada, triticale, centeno, arroz, maíz, mijo), remolacha azucarera, caña de azúcar, colza, algodón, girasol, guisantes, judías y soja. A este respecto y de particular interés la aplicación en cultivo monocotiledóneos tales como cereales (trigo, cebada, centeno, triticale, sorgo), incluido maíz y arroz y cultivos partículas monocotiledóneas, pero también en cultivo dicotiledóneos tales como, por ejemplo, soja, colza, algodón, vid, plantas hortícolas, plantas frutales y plantas decorativas. Las combinaciones de herbicida-protector con protectores (I) también son adecuadas para combatir plantas perjudiciales en macizos y superficies de plantas útiles y decorativas tales como, por ejemplo, superficies de césped con césped útil o decorativo, en especial ballico, poa o grama común.

En las plantas útiles y de cultivo en las que se pueden usar las combinaciones de herbicida-protector con protectores (I) son de interés también cultivos mutantes completa o parcialmente tolerantes frente a algunos pesticidas o cultivos transgénicos completa o parcialmente tolerantes, por ejemplo, cultivos de maíz que son resistentes a glufosinatos o glifosatos, o cultivos de soja que son resistentes frente a imidazolinonas herbicidas. La ventaja particular de los protectores empleados de forma novedosa sin embargo es su acción eficaz en cultivos que normalmente no son suficientemente tolerantes frente a los pesticidas que se deben aplicar.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se pueden distribuir para la aplicación conjunta con pesticidas simultáneamente o en un orden discrecional con los principios activos y entonces están en disposición de reducir los efectos secundarios perjudiciales de estos principios activos en plantas de cultivo o eliminarlas por completo sin alterar o reducir sustancialmente la eficacia de estos principios activos frente a organismos perjudiciales indeseados. A este respecto también se pueden reducir sustancialmente o eliminar por completo los daños que se producen por la aplicación de varios pesticidas, por ejemplo, por varios herbicidas o por herbicidas en combinación con insecticidas o fungicidas. Por ello se puede ampliar de forma muy considerable el campo de aplicación de los pesticidas convencionales.

En el caso de que los agentes de acuerdo con la invención contengan pesticidas, estos agentes se aplican después de la correspondiente dilución directamente sobre la superficie de cultivo, sobre las plantas perjudiciales y/o útiles degerminadas o sobre las plantas perjudiciales y/o de cultivo ya emergidas. En caso de que los agentes de acuerdo con la invención no contengan ningún pesticida, estos agentes se pueden usar en el denominado procedimiento de mezcla en tanque, es decir, directamente después de la aplicación sobre la superficie que se debe tratar se produce por el usuario la mezcla y dilución de los productos formulados de forma independiente (= agente protector de plantas útiles y pesticidas) o temporalmente antes de la aplicación de un pesticida o temporalmente después de la aplicación de un pesticida o para el tratamiento de la simiente, es decir, por ejemplo, para la desinfección de la simiente de planta ... Se prefiere la aplicación próxima en el tiempo del protector con el pesticida, en particular cuando el protector se aplica después del herbicida sobre las plantas.

- Los efectos ventajosos de los compuestos (I) de acuerdo con la invención se observan cuando se emplean junto con los pesticidas en la preemergencia o en la postemergencia, por ejemplo, con aplicación simultánea como mezcla en tanque o como co-formulación o con una aplicación independiente en paralelo o de forma sucesiva (aplicación dividida). También es posible repetir varias veces la aplicación. En ocasiones puede ser razonable combinar una aplicación de preemergencia con una aplicación de postemergencia. La mayoría de las veces es razonable la aplicación como aplicación de postemergencia sobre la planta útil o de cultivo con aplicación simultánea o posterior del pesticida. Se considera también la aplicación de los compuestos (I) de acuerdo con la invención durante la desinfección de la simiente, el tratamiento (por inmersión) de plántulas (por ejemplo arroz) o el tratamiento de otro material de propagación (por ejemplo, tubérculos de patata).
- Con frecuencia, durante la aplicación de los compuestos (I) de acuerdo con la invención en combinación con herbicidas, aparte del efecto protector, se observan también refuerzos de la acción en la acción herbicida frente a plantas perjudiciales. Además está mejorado en muchos casos el crecimiento de las plantas útiles y de cultivo y se pueden aumentar los rendimientos de la cosecha.
- Los agentes de acuerdo con la invención pueden contener uno o varios pesticidas. Como pesticidas se consideran, por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, acaricidas y nematocidas que respectivamente en caso de la aplicación en solitario darían como resultado daños fitotóxicos en las plantas de cultivo o en cuyo caso sería probable un daño. Son de interés particular los correspondientes principios activos pesticidas de los grupos de los herbicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas y fungicidas, en particular herbicidas.
- La proporción en peso de protector con respecto a pesticida se puede variar dentro de amplios límites y por norma general se encuentra en el intervalo de 1:100 a 100:1, preferentemente 1:20 a 20:1, en particular 1:10 a 10:1. La proporción en peso óptima de protector con respecto a pesticida por norma general depende tanto del protector respectivamente empleado y el respectivo pesticida como del tipo de la planta útil o de cultivo que se ha de proteger. La dosis de aplicación requerida de protector se puede variar en función del pesticida usado y el tipo de la planta útil que se debe proteger dentro de amplios límites y se encuentra, por norma general, en el intervalo de 0,001 a 10 kg, preferentemente de 0,01 a 1 kg, en particular de 0,05 a 0,5 kg de protector por hectárea. Las cantidades y proporciones en peso necesarios para un tratamiento exitoso se pueden establecer mediante sencillos ensayos previos.
- En el caso de una desinfección de simiente se emplean, por ejemplo, de 0,005 a 20 g de protector por kilogramo de simiente, preferentemente de 0,01 a 10 g de protector por kilogramo de simiente, en particular de 0,05 a 5 g de protector por kilogramo de simiente.
- Cuando se emplean soluciones de protector en el tratamiento de la simiente y la simiente o los plantones se humedecen con las soluciones, entonces la concentración adecuada por norma general se encuentra en el intervalo de 1 a 10000 ppm, preferentemente de 100 a 1000 ppm en relación con el peso. Las cantidades y proporciones en peso necesarias para un tratamiento exitoso se pueden establecer mediante sencillos ensayos previos.
- Los protectores se pueden formular habitualmente por separado o junto con los pesticidas. Por tanto, también son objeto los agentes protectores de plantas útiles o de plantas de cultivo.
- Se prefiere la aplicación conjunta de protector y pesticida, en particular la de protector y herbicida como formulación final o la aplicación en el procedimiento de mezcla en tanque.
- Así mismo se prefiere la aplicación del protector (I) en el tratamiento de la simiente con aplicación posterior de pesticidas, preferentemente herbicidas, después de la siembra en el procedimiento de pre- o postemergencia.
- Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales se pueden emplear como tales o en forma de sus preparaciones (formulaciones) con otras sustancias con actividad pesticida, tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, nematocidas, rícidias, fungicidas, protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento de forma combinada, por ejemplo, como formulación terminada o como mezclas en tanque. Las formulaciones de combinación a este respecto se pueden preparar a base de las formulaciones que se han mencionado anteriormente, teniéndose que tener en cuenta las propiedades físicas y estabildades de los principios activos que se deben combinar.
- Como componentes de combinación para los principios activos de acuerdo con la invención en formulaciones de mezcla o en la mezcla en tanque se pueden emplear, por ejemplo, principios activos conocidos, preferentemente herbicidas, que se basan en una inhibición de, por ejemplo, acetolactata sintasa, acetil-coenzima-A-carboxilasa, PS I, PS II, HPPDO, fitoeno-desaturasa, protoporfirinógeno-oxidasa, glutamina-sintetasa, biosíntesis de celulosa, 5-enolpiruvilshikimat-3-fosfato-sintetasa. Tales compuestos y también otros compuestos que se pueden emplear con un mecanismo de acción parcialmente desconocido diferente están descritos, por ejemplo, Weed Research 26, 441-445 (1986), o en el libro de texto "The Pesticide Manual", 12. Edición 2000, o 13. Edición 2003 o 14. Edición 2006/2007, o en el correspondiente "e-Pesticide Manual", Versión 4 (2006), respectivamente publicado por British Crop Protection Council, (denominado en lo sucesivo de forma abreviada "PM") y la bibliografía citada allí. Están disponibles listas de "nombres comunes" también en el "The Compendium of Pesticide Common Names" en Internet. Como herbicidas conocidos por la bibliografía que se pueden combinar con los compuestos de fórmula (I) se pueden mencionar por ejemplo los siguientes principios activos (nota: los compuestos están denominados con el "nombre

común" según la International Organization for Standardization (ISO) o con el nombre común, dado el caso junto con un número de código habitual):

acetoclor; acibenzolar-S-metilo; acifluorofeno (-sodio); aclonifeno; AD-67; AKH 7088, es decir, [[[1-[5-[2-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-nitrofenil]-2-metoxietilideno]-amino]-oxi]-acético y éster de metilo de ácido [[[1-[5-[2-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-nitrofenil]-2-metoxietilideno]-amino]-oxi]-acético; alaclor; aloxidima (-sodio); ametrina; amicarbazona, amidoclor, amidosulfurona; aminopirralida; amitrol; AMS, es decir, sulfamato de amonio; ancimidol; anilofos; asulam; atrazina; aviglicina; azafenidina, azimsulfurona (DPX-A8947); aziprotrina; barban; BAS 516 H, es decir, 5-fluoro-2-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona; beflubutamida (UBH-509), benazolina (-etilo); bencarbazona; benfluralina; benfuresato; benoxacor; bensulfurona (-metilo); bensulida; bentazona; benzfendizona; benzobiciclona, benzofenap; benzofluor; benzoilprop (-etilo); benztiazorona; bialafós; bifenox; bispiribac (-sodio) (KIH-2023); borax; bromacilo; bromobutida; bromofenoxima; bromoxinilo; bromurona; buminafós; busoxinona; butaclor; butafenacilo, butamifos; butenaclor (KH-218); butidazol; butralina; butroxidima, butilato; cafenstrol (CH-900); carbetamida; carfentrazona (-etilo); CDAA, es decir, 2-cloro-*N,N*-di-2-propenilactamida; CDEC, es decir, éster de 2-cloroalilo de ácido dietilditiocarbamídico; clometoxifeno; clorambeno; clorazifop-butilo, clorobromurona; clorobufam; clorofenaco; clorofenprop; cloroflurecol (-metilo); cloroflurenol (-metilo); cloridazona; clorimurona (-etilo); cloromecuat (-cloruro); cloronitrofenol; cloroftalima (MK-616); clorotolurona; cloroxurona; cloroprofam; clorosulfurona; clorotal-dimetilo; clorotiamida; clorotolurona, cinidona (-metilo y -etilo), cinmetilina; cinosulfurona; clefoxidima, cletodima; clodinafop y sus derivados de éster (por ejemplo, clodinafop-propargilo); clofencet; clomazona; clomeprop; cloprop; cloproxidima; clopirralida; clopirasulfurona (-metilo), cloquintocet (-mexilo); cloransulam (-metilo), cumilurona (JC 940); cianamida; cianazina; cicloato; ciclosulfamurona (AC 104); cicloxidima; ciclurona; cihalofop y sus derivados de éster (por ejemplo, éster de butilo, DEH-112); cipercuat; ciprazina; ciprazol; ciprosulfamida; daimurona; 2,4-D, 2,4-DB; dalapon; daminozida; dazomet; *n*-decanol; desmedifam; desmetrina; di-alato; dicamba; diclobenilo; dicloromida; sales de dicloroprop (-P); diclofop y sus ésteres tales como diclofop-metilo; diclofop-P (-metilo); diclosulam, dietatil (-etilo); difenoxurona; difenzocuat (-metilsulfato); diflufenican; diflufenzopir (-sodio); dimefurona; dimepiperato, dimetaclor; dimetametrina; dimetazona; dimetenamida (SAN-582H); dimetenamida-P; ácido dimetilarsínico; dimetipina; dimetrasulfurona, dinitramina; dinoseb; dinoterb; difenamida; dipropetrina; sales de dicuat; ditiopir; diurona; DNOC; eglinazina-etilo; EL 77, es decir, 5-ciano-1-(1,1-dimetiletil)-*N*-metil-1H-pirazol-4-carboxamida; endotal; epprodan, EPTC; esprocarb; etalfuralina; etametsulfurona-metilo; etefona; etidimurona; etiozina; etofumesato; etoxifeno y sus ésteres (por ejemplo, éster de etilo, HN-252); etoxisulfurona, etobenzanida (HW 52); F5231, es decir, *N*-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]-fenil]-etanosulfonamida; fenclozazol(-etilo); fenclozima; fenoprop; fenoxan, fenoxaprop y fenoxaprop-P así como sus ésteres, por ejemplo, fenoxaprop-P-etilo y fenoxaprop-etilo; fenoxidima; fentrazamida, fenurona; sulfato ferroso; flamprop (-metilo o -isopropilo o -isopropilo-L); flamprop-M (-metilo o -isopropilo); flazasulfurona; florasulam, fluazifop y fluazifop-P y sus ésteres, por ejemplo, fluazifop-butilo y fluazifop-P-butilo; fluazolato, flucarbazona (-sodio), flucetosulfurona; flucloralina; flufenacet; flufenpir (-etilo); flumetralina; flumetsulam; flumeturona; flumicloraz (-pentilo), flumioxazina (S-482); flumipropina; fluometurona, fluorocloridona, fluorodifeno; fluoroglicofeno (-etilo); flupoxam (KNW-739); flupropacilo (UBIC-4243); flupropanoato; flupirsulfurona (-metilo)(-sodio); flurazol; flurenol (-butilo); fluridona; fluorocloridona; fluroxipir (-meptilo); flurprimidol, flurtamona; flutiacet (-metilo) (KIH-9201); flutiamida, fluxofenima; fomesafeno; foramsulfurona, forclorofenurona; fosamina; furilazol; furiloxifeno; ácido giberílico; glufosinato (-amonio); glifosato (-isopropilamonio); halosafeno; halosulfurona (-metilo); haloxifop y sus ésteres; haloxifop-P (= R-haloxifop) y sus ésteres; HC-252; hexazinona; imazametabenza (-metilo); imazametapir, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquina y sales tales como la sal de amonio; imazetametapir; imazetapir; imazosulfurona; inabenfida; indanofano; ácido indol-3-acético; ácido 4-indol-3-ilbutírico; yodosulfurona-metil (-sodio); ioxinilo; isocarbamida; isopropalina; isoproturona; isourona; isoxabeno; isoxaclortol, isoxadifeno (-etilo); isoxaflutol, isoxapirifop; carbutilato; lactofeno; lenacilo; linurona; hidrazida de ácido maleico (MAC), MCPA; MCPB; mecoprop(-P); mefenacet; mefenpir (-dietilo); mefluidida; mepicuat (-cloruro); mesosulfurona (-metilo); mesotriona, metam; metamifop; metamitrona; metazaclor; metabenciazurona; metam; metazol; metoxifenona; ácido metilarsínico; metil-ciclopropeno; metildimrona; metilisotiocianato; metabenziazurona; metabenzurona; metabromurona; (alfa-)metolaclor; metosulam (XRD 511); metoxurona; metribuzina; metsulfurona-metilo; molinato; monalida; dihidrógenosulfato de monocarbamida; monolinurona; monurona; MT 128, es decir 6-cloro-*N*-(3-cloro-2-propenil)-5-metil-*N*-fenil-3-piridazinamina; MT 5950, es decir *N*-[3-cloro-4-(1-metiletil)-fenil]-2-metilpentanamida; naproanilida; napropamida; naptalam; NC 310, es decir 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benciloxipirazol; neburona; nicosulfurona; nipiraclorofeno; nitalina; nitrofenol; mezcla de nitrofenolato; nitrofluorofeno; ácido nonanoico; norflurazona; orbencarb; ortasulfamurona; oxabetrinilo; orizalina; oxadiargilo (RP-020630); oxadiazona; oxasulfurona, oxaziclomefona, oxifluorofeno; paclobutrazol; paracuat(-dicloruro); pebulato; ácido pelargónico, pendifmetalina; penoxsulam; pentaclorofenol; pentanoclor; pentoxazona, perfluidona; petoxamida; fenisofam; fenmedifam; picloram; picolinafeno, pinoxadeno, piperofos; piributicarb; pirifenop-butilo; pretilaclor; primisulfurona (-metilo); probenazol; procarbazona (-sodio), procirozina; prodiamina; profuralina; profoxidima; prohexadiona (-calcio); prohidrojasmona; proglinazina (-etilo); prometona; prometrina; propaclor; propanilo; propaquizafop; propazina; profam; propisoclor; propoxicarbazona (-sodio) (MKH-6561); *n*-propil-dihidrojasmonato; propizamida; prosulfalina; prosulfocarb; prosulfurona (CGA-152005); prinaclor; piraclonilo; piraflufeno (-etilo) (ET-751); pirasulfotol; pirazolinol; pirazona; pirazosulfurona (-etilo); pirazoxifeno; piribenzoxima, piributicarb, piridafol, piridato; pirifitalida; piriminobac (-metilo) (KIH-6127); pirimisulfan (KIH-5996); piritiobac (-sodio) (KIH-2031); piroxasulfona (KIH-485); piroxofop y sus ésteres (por ejemplo, éster de propargilo); piroxsulam; quinclorac; quinmerac; quinoclamina, quinoxifop y sus derivados de éster, quizalofop y quizalofop-P y sus derivados de éster, por ejemplo, quizalofop-etilo; quizalofop-P-tefurilo y -etilo; renridurona; rimsulfurona (DPX-E 9636); S 275, es decir, 2-[4-

cloro-2-fluoro-5-(2-propinilo)-fenil]-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol; saflufenacilo (*N*-[2-cloro-4-fluoro-5-(3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluorometil)-3,6-dihidro-1(2H)-pirimidinil)benzoi]-*N*-isopropil-*N*-metilsulfamida), secbumetona; setoxidima; sidurona; simazina; simetrina; sintofeno; SN 106279, es decir ácido 2-[[7-[2-cloro-4-(trifluoro-metil)-fenoxi]-2-naftalenil]-oxi]-propanoico y éster de metilo del mismo; sulcotriona, sulfentrazona (FMC-97285, F-6285); sulfazurona; sulfometurona (-metilo); sulfosato (ICI-A0224); sulfosulfurona, TCA; tebutam (GCP-5544); tebutiurona; tecnaceno; tembotriona; tefuriltriona; tepraloxidima, terbacilo; terbucarb; terbuclor; terbumetona; terbutilazina; terbutrina; TFH 450, es decir, *N,N*-dietil-3-[(2-etil-6-metilfenil)-sulfonil]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamida; tenilclor (NSK-850); tiafluamida, tiazafurona; tiazopir (Mon-13200); tidiazimina (SN-24085); tidiazurona; tiencarbazona; tifensulfurona (-metilo); tiobencarb; Ti 35; tiocarbacilo; topamezona; tralcoxidima; tri-alato; triasulfurona; triaciflam, triazofenamida; tribenuron (-metilo); triclopir; tridifano; trietacina; trifloxisulfurona; trifluralina; triflusulfurona y ésteres (por ejemplo éster de metilo, DPX-66037); trimeturona; trinexapac; tritosulfurona, tsitodef; uniconazol; vernolato; WL 110547, es decir, 5-fenoxi-1-[3-(trifluorometil)-fenil]-1 H-tetrazol; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600 y MBH-001.

Los insecticidas que pueden causar en solitario o junto con herbicidas daños en plantas son, por ejemplo, los siguientes:

organofosfatos, por ejemplo, terbufós (Counter[®]), fonofós (Dyfonate[®]), forato (Thimet[®]), clorpirifós (Reldan[®]), carbamatos tales como carbofurano (Furadan[®]), insecticidas piretroides tales como teflutrina (Force[®]), deltametrina (Decis[®]) y tralometrina (Scout[®]) así como otros agentes insecticidas con mecanismos de acción de otro tipo.

Los herbicidas cuyos efectos secundarios fitotóxicos en plantas de cultivo se pueden reducir mediante compuestos de fórmula (I) son, por ejemplo, herbicidas del grupo de los carbamatos, tiocarbamatos, haloacetanilidas, derivados de ácido fenoxi-, naftoxi- y fenoxifenoxicarboxílico sustituidos así como derivados de ácido heteroariloxifenoxialcanocarboxílicos tales como éster de ácido quinoliloxi-, quinoxaliloxi-, piridiloxi-, benzoxazoliloxi- y benzotiazoliloxifenoxialcanocarboxílico, ciclohexanodionoxima, benzoilciclohexanodiona, benzoilisoaxazol, benzoilpirazol, imidazolinona, derivados de ácido pirimidiniloxi-piridincarboxílico, derivados de ácido pirimidiloxibenzoico, sulfonilureas, sulfonilaminocarbonil triazolinonas, derivados de triazolo-pirimidin-sulfonamida, derivados de ácido fosfínico y sus sales, derivados de glicina, triazolinonas, triacinas así como éster de ácido *S*-(*N*-aril-*N*-alquilcarbamoilmetil)-ditiofosfórico, ácidos piridincarboxílicos, piridinas, piridincarboxamidas, 1,3,5-triacinas y otros.

A este respecto se prefieren ésteres de ácido fenoxifenoxi- y heteroariloxifenoxicarboxílico y sus sales, ciclohexanodionoximas, benzoilciclohexanodiona, benzoilisoaxazol, benzoilpirazol, sulfonilureas, sulfonilaminocarbonil triazolinona, imidazolinonas así como mezclas de los principios activos mencionados entre sí y/o con principios activos que se amplían para ampliar el espectro de acción de los herbicidas, por ejemplo, bentazona, cianacina, atracina, bromoxinilo, dicamba y otros herbicidas de hoja.

Son herbicidas adecuados que se pueden combinar con los protectores de acuerdo con la invención por ejemplo:

A) herbicidas del tipo de los derivados de ácido fenoxifenoxi- y heteroariloxifenoxicarboxílico tales como

A1) derivados de ácido fenoxifenoxi- y benciloxifenoxi-carboxílico, por ejemplo, éster de metilo de ácido 2-(4-(2,4-diclorofenoxi)-fenoxi)-propiónico (diclofop-metilo),

éster de metilo de ácido 2-(4-(4-bromo-2-clorofenoxi)fenoxi)propiónico (documento DE-A 26 01 548),

éster de metilo de ácido 2-(4-(4-bromo-2-fluorofenoxi)fenoxi)propiónico (documento US-A 4.808.750),

éster de metilo de ácido 2-(4-(2-cloro-4-trifluorometilfenoxi)fenoxi)propiónico (documento DE-A 24 33 067),

éster de metilo de ácido 2-(4-(2-fluoro-4-trifluorometilfenoxi)fenoxi)propiónico (documento US-A 4.808.750),

éster de metilo de ácido 2-(4-(2,4-diclorobencil)fenoxi)propiónico (documento DE-A 24 17 487),

éster de etilo de ácido 4-(4-(4-trifluorometilfenoxi)fenoxi)pent-2-enoico

éster de metilo de ácido 2-(4-(4-trifluorometilfenoxi)fenoxi)propiónico (documento DE-A 24 33 067);

éster de butilo de ácido (*R*)-2-[4-(4-ciano-2-fluorofenoxi)fenoxi]propiónico (cihalofop-butilo)

A2) Derivados de ácido heteroariloxifenoxi-alcanocarboxílico "mononucleares", por ejemplo,

éster de etilo de ácido 2-(4-(3,5-dicloropiridil-2-oxi)fenoxi)propiónico (documento EP-A 0 002 925),

éster de propargilo de ácido 2-(4-(3,5-dicloropiridil-2-oxi)fenoxi)propiónico (documento EP-A 0 003 114),

éster de metilo de ácido (*RS*)- o (*R*)-2-(4-(3-cloro-5-trifluorometil-2-piridiloxi)fenoxi)propiónico (haloxifop-metilo o haloxifop-P-metilo),

- éster de etilo de ácido 2-(4-(3-cloro-5-trifluorometil-2-piridiloxi)fenoxi)propiónico (documento EP-A 0 003 890),
éster de propargilo de ácido 2-(4-(5-cloro-3-fluoro-2-piridiloxi)fenoxi)propiónico (clodinafop-propargilo),
éster de butilo de ácido (*RS*)- o (*R*)-2-(4-(5-trifluorometil-2-piridiloxi)fenoxi)propiónico (fluazifop-butilo o fluazifop-P-butilo);
- 5 ácido (*R*)-2-[4-(3-cloro-5-trifluorometil-2-piridiloxi)fenoxi]propiónico
- A3) derivados de ácido heteroariloxifenoxi-alcanocarboxílico "binucleares", por ejemplo, éster de metilo y éster de etilo de ácido (*RS*)- o (*R*)-2-(4-(6-cloro-2-cinoxaliloxi)fenoxi)propiónico (quizalofop-metilo y etilo o quizalofop-P-metilo y -P-etilo),
éster de metilo de ácido 2-(4-(6-fluoro-2-cinoxaliloxi)fenoxi)propiónico (véase J. Pest. Sci. Vol. 10, 61 (1985)),
- 10 éster de 2-isopropilidenaminooxi-etilo de ácido (*R*)-2-(4-(6-cloro-2-cinoxaliloxi)fenoxi)propiónico (propaquizafop),
éster de etilo de ácido (*RS*)- o (*R*)-2-(4-(6-clorobenzoxazol-2-il-oxi)fenoxi)propiónico (fenoxaprop-etilo o fenoxaprop-P-etilo),
éster de etilo de ácido 2-(4-(6-clorobenzotiazol-2-iloxi)fenoxi)propiónico (documento DE-A-26 40 730),
- 15 éster de tetrahydro-2-furilmetilo de ácido (*RS*)- o (*R*)-2-(4-(6-clorocinoxaliloxi)fenoxi)propiónico (documento EP-A-0 323 727),
(*R*)-2-[4-(6-cloro-1,3-benzoxazol-2-iloxi)fenoxi]-2'-fluoro-*N*-metilpropionanilida (metamifop);
- B) Herbicidas de la serie de las sulfonilureas tales como pirimidin- o triacilaminocarbonil-[benceno-, piridin-, pirazol-, tiofen- y (alquilsulfonil)-alquilamino-]-sulfamidas. Se prefieren como sustituyentes en el anillo de pirimidina o en el anillo de triazina alcoxi, alquilo, haloalcoxi, haloalquilo, halógeno o dimetilamino, pudiéndose combinar todos los sustituyentes de forma independiente entre sí. Son sustituyentes preferentes en la parte de benceno, piridina, pirazol, tiofeno o (alquilsulfonil)-alquilamino alquilo, alcoxi, halógeno, nitro, alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxiaminocarbonilo, halogenoalcoxi, halogenoalquilo, alquilcarbonilo, alcoxialquilo, (alcanosulfonil)alquilamino. Tales sulfonilureas adecuadas son, por ejemplo
- 20 B1) Fenil- y bencilsulfonilureas y compuestos relacionados, por ejemplo,
- 25 1-(2-clorofenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metilo-1,3,5-triazin-2-il)urea (clorsulfurona),
1-(2-etoxicarbonilfenilsulfonil)-3-(4-cloro-6-metoxipirimidin-2-il)urea (clorimurona-etilo),
1-(2-metoxifenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea (metsulfurona-metilo),
1-(2-cloroetoxifenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea (triasulfurona),
1-(2-metoxicarbonilfenilsulfonil)-3-(4,6-dimetilpirimidin-2-il)urea (sulfometurona-metilo),
- 30 1-(2-metoxicarbonilfenilsulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-3-metilurea (tribenurona-metilo),
1-(2-metoxicarbonilbenzilsulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea (bensulfurona-metilo),
1-(2-metoxicarbonilfenilsulfonil)-3-(4,6-bis-(difluorometoxi)pirimidin-2-il)-urea (primisulfurona-metilo),
3-(4-etil-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2,3-dihidro-1,1-dioxo-2-metilbenzo-[b]tiofen-7-sulfonil)urea (documento EP-A 0 796 83),
- 35 3-(4-etoxi-6-etil-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2,3-dihidro-1,1-dioxo-2-metilbenzo[b]-tiofen-7-sulfonil)urea (documento EP-A 0 079 683),
3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2-metoxicarbonil-5-yodo-fenil-sulfonil)urea (documento WO 92/13845),
éster de metilo de ácido 2-[4-dimetilamino-6-(2,2,2-trifluoroetoxi)-1,3,5-triazin-2-ilcarbamoiilsulfamoil]-3-metil-benzoico (DPX-66037, triflurosulfurona-metilo),
- 40 éster de oxetan-3-ilo de ácido 2-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-carbamoiilsulfamoil]benzoico (CGA-277476, oxasulfurona),
éster de metilo de ácido 4-yodo-2-[3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)ureidosulfonil]-benzoico, sal sódica (yodosulfurona-metilo-sodio),
éster de metilo de ácido 2-[3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)ureidosulfonil]-4-metansulfonilamino-metil-benzoico (mesosulfurona-metilo, documento WO 95/10507),

- N,N*-dimetil-2-[3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)ureidosulfonil]-4-formilamino-benzamida (foramsulfurona, documento WO 95/01344),
- 1-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-3-[2-(2-metoxietoxi)fenilsulfonil]urea (cinosulfurona),
- 5 éster de metilo de ácido 2-[(4-etoxi-6-metilamino-1,3,5-triazin-2-il)carbamoilsulfamoil]benzoico (etametsulfurona-metilo),
- 1-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-3-[2-(3,3,3-trifluoropropil)fenilsulfonil]-urea (prosulfurona),
- 1-(4-metoxi-6-trifluorometil-1,3,5-triazin-2-il)-3-(2-trifluorometilbencenosulfonil)-urea (tritosulfurona),
- N*-[(4-metilpirimidin-2-il)carbamoil]-2-nitrobencenosulfonamida (monosulfurona),
- benzoato de metil-2-[[[4-metoxi-6-(metiltio)pirimidin-2-il]carbamoil]amino)sulfonilo],
- 10 B2) Tienilsulfonilureas, por ejemplo,
- 1-(2-metoxicarboniltiofen-3-il)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)urea (tifensulfurona-metilo);
- B3) Pirazolilsulfonilureas, por ejemplo
- 1-(4-etoxicarbonil-1-metilpirazol-5-il-sulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea (pirazosulfurona-etilo),
- 15 éster de metilo de ácido 3-cloro-5-(4,6-dimetoxipirimidin-2-ilcarbamoilsulfamoil)-1-metil-pirazol-4-carboxílico (halosulfurona-metilo),
- éster de metilo de ácido 5-(4,6-dimetilpirimidin-2-il-carbamoilsulfamoil)-1-(2-piridil)-pirazol-4-carboxílico (NC-330, véase Brighton Crop Prot. Conference 'Weeds' 1991, Vol. 1, pág. 45 y siguientes),
- 1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-3-[1-metil-4-(2-metil-2*H*-tetrazol-5-il)pirazol-5-ilsulfonil]urea (DPX-A8947, acimsulfurona),
- N*-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbamoil]-4-(5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-sulfonamida;
- 20 B4) Derivados de sulfondiamida, por ejemplo,
- 3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-(*N*-metil-*N*-metilsulfonilaminosulfonil)-urea (amidossulfurona) y sus análogos estructurales (documento EP-A 0 131 258 y Z. Pfl. Krankh. Pfl. Schutz, cuaderno especial XII, 489-497 (1990));
- B5) Piridilsulfonilureas, por ejemplo,
- 1-(3-*N,N*-dimetilaminocarbonilpiridin-2-ilsulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea (nicosulfurona),
- 25 1-(3-etilsulfonilpiridin-2-ilsulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea (rimsulfurona),
- éster de metilo de ácido 2-[3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)ureidosulfonil]-6-trifluorometil-3-piridin-carboxílico, sal sódica (DPX-KE 459, flupirsulfurona-metilo-sodio),
- 3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-(3-*N*-metilsulfonil-*N*-metil-aminopiridin-2-il)-sulfonilurea o sus sales (documentos DE-A 40 00 503 y DE-A 40 30 577), 1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-3-(3-trifluorometil-2-piridilsulfonil)urea (flazasulfurona),
- 30 1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-3-[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)-2-piridilsulfonil]urea-sal sódica (trifloxisulfurona-sodio),
- Metoxiacetato de (1*RS*,2*RS*;1*RS*,2*SR*)-1-{3-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-ilcarbamoil)sulfamoil]-2-piridil}-2-fluoropropil (flucetosulfurona);
- B6) Alcoxifenoxisulfonilureas, por ejemplo
- 3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-(2-etoxifenoxi)-sulfonilurea o sus sales (etoxisulfurona);
- 35 B7) Imidazolilsulfonilureas, por ejemplo
- 1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-3-(2-etilsulfonilimidazo[1,2-*a*]piridin-3-il)sulfonilurea (MON 37500, sulfosulfurona),
- 1-(2-cloroimidazo[1,2-*a*]piridin-3-ilsulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea (imazosulfurona),
- 2-cloro-*N*-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbamoil]-6-propilimidazo[1,2-*b*]piridazin-3-sulfonamida;
- B8) Fenilaminosulfonilureas, por ejemplo
- 40 1-[2-(ciclopropilcarbonil)fenilaminosulfonil]-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea (ciclosulfamurona),

1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-3-[2-(dimetilcarbamoil)fenilsulfamoil]-urea (ortosulfamurona);

C) Cloracetanilidas, por ejemplo

acetoclor, alaclor, butaclor, dimetaclor, dimetenamida, dimetenamida-p; metazaclor, metolaclor, s-metolaclor, petoxamida, pretilaclor, propaclor, propisoclor y teniclor;

5 D) Tiocarbamatos, por ejemplo

tiocarbamato de S-etil-N,N-dipropilo (EPTC),

tiocarbamato de S-etil-N,N-diisobutilo (butilato),

cicloato, dimepiperato, esprocarb, molinato, orbencarb, pebulato, prosulfocarb, tiobencarb, tiocarbacilo, tri-alato, vernolato;

10 E) Ciclohexanodionoxima, por ejemplo

aloxidima, butroxidima, cletodima, cloproxidima, cicloxidima, profoxidima, setoxidima, tepraloxidima y tralcoxidima;

F) Imidazolinonas, por ejemplo

imazametabenz-metilo, imazapic, imazamox, imazapir, imazaquina e imzetapir;

G) Derivados de triazolopirimidinsulfonamida, por ejemplo

15 cloransulam-metilo, diclosulam, florasulam, flumetsulam, metosulam y penoxsulam, es decir, 2-(2,2-difluoroetoxi)-N-(5,8-dimetoxi[1,2,4]triazolo[1,5-c]pirimidin-2-il)-6-(trifluorometil)-bencenosulfonamida y piroxsulam, es decir, N-(5,7-dimetoxi[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il)-2-metoxi-4-(trifluorometil)-3-piridinsulfonamida;

H) Benzoilciclohexanodionas, por ejemplo

2-(2-cloro-4-metilsulfonilbenzoil)-ciclohexan-1,3-diona (SC-0051, sulcotriona),

20 2-(2-nitrobenzoil)-4,4-dimetil-ciclohexan-1,3-diona (documento EP-A 0 274 634),

2-(2-nitro-3-metilsulfonilbenzoil)-4,4-dimetilciclohexan-1,3-diona (documento WO 91/13548),

2-[4-(metilsulfonil)-2-nitrobenzoil]-1,3-ciclohexanodiona (mesotriona),

2-[2-cloro-3-(5-cianometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-(5-cianometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

25 2-[2-cloro-3-(5-etoximetil-4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-(5-etoximetil-4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetoxi)metil]-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona (tembotriona),

2-[2-cloro-3-[(2,2-difluoroetoxi)metil]-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

30 2-[2-cloro-3-[(2,2-difluoroetoxi)metil]-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-[(2,2,3,3-tetrafluoro-propoxi)metil]-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-[(2,2,3,3-tetrafluoro-propoxi)metil]-4-(metilsulfonil)benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-(ciclopropilmetoxi)-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-(ciclopropilmetoxi)-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

35 2-[2-cloro-3-(tetrahidrofuran-2-ilmetoximetil)-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-(tetrahidrofuran-2-ilmetoximetil)-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona (tefuriltriona),

2-[2-cloro-3-[2-(2-metoxietoxi)-etoximetil]-4-(etilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

2-[2-cloro-3-[2-(2-metoxietoxi)-etoximetil]-4-(metilsulfonil)-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona,

- 3-({2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)piridin-3-il}carbonil)-biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona (documento WO 2001094339);
- I) Benzoilisoxazoles, por ejemplo
- 5-ciclopropil-[2-(metilsulfonil)-4-(trifluorometil)benzoil]isoxazol (isoxaflutol),
- 5 (4-cloro-2-mesilfenil)(5-ciclopropil-1,2-oxazol-4-il)metanona (isoxaclorotol);
- J) Benzoilpirazoles, por ejemplo
- 2-[4-(2,4-dicloro-*m*-toluol)-1,3-dimetilpirazol-5-iloxi]-4'-metilacetofenona (benzofenap),
- 4-sulfonato de 4-(2,4-diclorobenzoil)-1,3-dimetilpirazol-5-il-tolueno (pirazolinato),
- 2-[4-(2,4-diclorobenzoil)-1,3-dimetilpirazol-5-iloxi]acetofenona (pirazoxifeno);
- 10 5-hidroxi-1-metil-4-[2-(metilsulfonil)-4-trifluorometil-benzoil]-pirazol (documento WO 01/74785),
- 1-etil-5-hidroxi-4-[2-(metilsulfonil)-4-trifluorometil-benzoil]-pirazol (documento WO 01/74785),
- 1,3-dimetil-5-hidroxi-4-[2-(metilsulfonil)-4-trifluorometil-benzoil]-pirazol (documento WO 01/74785),
- 1-etil-5-hidroxi-3-metil-4-[2-(metilsulfonil)-4-trifluorometil-benzoil]-pirazol (pirasulfotol, documento WO 01/74785),
- 5-hidroxi-1-metil-4-[2-cloro-3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-metilsulfonil-benzoil]-pirazol (documento WO 99/58509),
- 15 5-hidroxi-1-metil-4-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonil-benzoil]-pirazol (topramezona, documento WO 99/58509),
- 1-etil-5-hidroxi-3-metil-4-[2-metil-4-metilsulfonil-3-(2-metoxi-etilamino)-benzoil]-pirazol (documento WO 96/26206),
- 3-ciclopropil-5-hidroxi-1-metil-4-[2-metil-4-metilsulfonil-3-(2-metoxi-etilamino)-benzoil]-pirazol (documento WO 96/26206),
- 20 5-benzoxi-1-etil-4-[2-metil-4-metilsulfonil-3-(2-metoxi-etilamino)-benzoil]-pirazol (documento WO 96/26206),
- 1-etil-5-hidroxi-4-(3-dimetilamino-2-metil-4-metilsulfonil-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 5-hidroxi-1-metil-4-(2-cloro-3-dimetilamino-4-metilsulfonil-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 1-etil-5-hidroxi-4-(3-alilamino-2-cloro-4-metilsulfonil-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 1-etil-5-hidroxi-4-(2-metil-4-metilsulfonil-3-morfolino-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 25 5-hidroxi-1-isopropil-4-(2-cloro-4-metilsulfonil-3-morfolino-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 3-ciclopropil-5-hidroxi-1-metil-4-(2-cloro-4-metilsulfonil-3-morfolino-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 1,3-dimetil-5-hidroxi-4-(2-cloro-4-metilsulfonil-3-pirazol-1-il-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 1-etil-5-hidroxi-3-metil-4-(2-cloro-4-metilsulfonil-3-pirazol-1-il-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 1-etil-5-hidroxi-4-(2-cloro-4-metilsulfonil-3-pirazol-1-il-benzoil)-pirazol (documento WO 96/26206),
- 30 (5-hidroxi-1-metil-1H-pirazol-4-il)(3,3,4-trimetil-1,1-dioxido-2,3-dihidro-1-benzotien-5-il)metanona (documento US2002/0016262),
- propan-1-sulfonato de 1-metil-4-[(3,3,4-trimetil-1,1-dioxido-2,3-dihidro-1-benzotien-5-il)carbonil]-1H-pirazol-5-ilo (documentos US2002/0016262, WO 2002/015695);
- 3-(2-cloro-4-mesilbenzoil)-2-feniltiobiciclo[3.2.1]oct-2-en-4-ona (benzobiciclona);
- 35 K) Sulfonilaminocarboniltriazolinonas, por ejemplo
- sal sódica de 4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo-*N*-(2-trifluorometoxifenilsulfonil)-1*H*-1,2,4-triazol-1-carboxamida (flucarbazona-sodio),
- sal sódica de éster de metilo de ácido 2-(4,5-dihidro-4-metil-5-oxo-3-propoxi-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-sulfonilbenzoico (propoxicarbazona-Na),
- 40 3-carboxilato de metil-4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)carbonil-sulfamoil]-5-metiltiofeno

- (tiencarbazona-metilo);
- L) Triazolinonas, por ejemplo
- 4-amino-*N*-*tert*-butil-4,5-dihidro-3-isopropil-5-oxo-1,2,4-1*H*-triazol-1-carboxamida (amicarbazona),
- 2-(2,4-dicloro-5-prop-2-iniloxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-*a*]piridin-3(2*H*)-ona (azafenidina),
- 5 éster de etilo de ácido (*RS*)-2-cloro-3-[2-cloro-5-(4-difluorometil-4,5-dihidro-3-metil-5-oxo-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-4-fluorofenil]propiónico (carfentrazona-etilo),
- 2',4'-dicloro-5'-(4-difluorometil-4,5-dihidro-3-metil-5-oxo-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-metanosulfonanilida (sulfentrazona),
- 4-[4,5-dihidro-4-metil-5-oxo-3-(trifluorometil)-1*H*-1,2,4-triazol-1-il]-2-[(etilsulfonyl)amino]-5-fluorobencenocarbotioamida (bencarbazona);
- 10 M) Ácidos fosfínicos y derivados, por ejemplo
- sal de amonio de ácido 4-[hidroxi(metil)fosfinoil]-L-homoalanil-L-alanil-L-alanina (bilanafós), DL-homoalanin-4-il(metil)fosfínico (glufosinato-amonio);
- N) Derivados de glicina, por ejemplo
- N*-(fosfonometil)glicina y sus sales (glifosatos y sales, por ejemplo, la sal sódica o la sal de isopropilamonio),
- 15 sal de trimesio de *N*-(fosfonometil)glicina (sulfosato);
- O) Derivados de ácido pirimidinilo-piridincarboxílico; derivados de ácido pirimidinilo-benzoico o derivados de ácido pirimidinilo-benzoico, por ejemplo
- éster de bencilo de ácido 3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-oxi-piridin-2-carboxílico (documento EP-A 0 249 707),
- éster de metilo de ácido 3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-oxi-piridin-2-carboxílico (documento EP-A 0 249 707),
- 20 éster de 1-(etoxicarbonil-oxietilo) de ácido 2,6-bis[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-oxi]-benzoico (documento EP-A 0 472 113),
- ácido 2,6-bis[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-oxi]-benzoico (bispiribac-sodio),
- isopropil-4-[[[2-[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)oxi]fenil]metil]amino]benzoato (piribambenz-isopropilo, documento WO 2002034724),
- 25 propil-4-[[[2-[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)oxi]fenil]metil]amino]benzoato (piribambenz-propilo, documento WO 2002034724),
- piribenzoxima, piriftalida, piriminobac-metilo, piritiobac-sodio, pirimisulfan;
- P) Éster de ácido *S*-(*N*-aril-*N*-alquil-carbamoylmetil)-ditioposfónico, tal como ditioposfato de *S*-[*N*-(4-clorfenil)-*N*-isopropil-carbamoylmetil]-*O*,*O*-dimetilo (anilofos);
- 30 Q) Triazinonas, por ejemplo
- 3-ciclohexil-6-dimetilamino-1-metil-1,3,5-triazina-2,4-(1*H*,3*H*)-diona (hexazinona),
- 4-amino-4,5-dihidro-3-metil-6-fenil-1,2,4-triazin-5-ona (metamitrona),
- 4-amino-6-*tert*-butil-4,5-dihidro-3-metiltio-1,2,4-triazin-5-ona (metribuzina);
- R) Ácidos piridincarboxílicos, por ejemplo
- 35 aminopirralida, clopiralida, fluroxipir, picloram y triclopir;
- S) Piridinas, por ejemplo,
- ditiopir y tiazopir;
- T) Piridincarboxamidas, por ejemplo
- diflufenican y picolinafeno;
- 40 U) 1,3,5-triazinas, por ejemplo

ametrina, atrazina, cianazina, dimetametrina, prometona, prometrina, propazina, simazina, simetrina, terbumetona, terbutilazina, terbutrina y trietazina;

V) Reguladores del crecimiento vegetal, por ejemplo

forclorfenurona y tidiazurona;

5 W) Cetoenoles, por ejemplo,

2,2-dimetilpropionato de 8-(2,6-dietil-*p*-tolil)-1,2,4,5-tetrahidro-7-oxo-7*H*-pirazolo[1,2-*d*][1,4,5]oxadiazepin-9-ilo (pinoxadeno);

X) Pirazoles, por ejemplo,

10 3-[5-(difluorometoxi)-1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-ilmethylsulfonil]-4,5-dihidro-5,5-dimetil-1,2-oxazoles (pinoxasulfona).

Los herbicidas de los grupos A a W son conocidos, por ejemplo, a partir de los documentos respectivamente mencionados anteriormente, de "The Pesticide Manual", The British Crop Protection Council, 14ª Edición, 2006 o del e-Pesticide Manual, Versión 4.0, British Crop Protection Council 2006 o también del "Compendium of Pesticide Common Names".

15 En el caso de la aplicación como formulaciones de principio activo o coformulaciones, las mismas contienen dado el caso por norma general los agentes adherentes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, de penetración, conservantes, anticongelantes y disolventes, cargas, vehículos y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación y agentes que influyen en el valor del pH y la viscosidad respectivamente habituales.

20 Los compuestos de la fórmula general (I) y sus combinaciones con uno o varios de los pesticidas mencionados se pueden formular dependiendo de los parámetros físicos, químicos y biológicos predefinidos de distintas formas. Como tipos de formulación son adecuados, por ejemplo:

25 - Concentrados emulsionables que se prepararan mediante disolución de los principios activos en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también hidrocarburos de mayor punto de ebullición o mezclas de los disolventes orgánicos con adición de uno o varios tensioactivos de tipo iónico y/o no iónico (emulsionantes). Son emulsionantes adecuados, por ejemplo, sales de calcio de ácido alquilarilsulfónico, poliglicolésteres de ácido graso, alquilarilpoliglicoléter, poliglicoléter de alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno y óxido de etileno, poliéter de alquilo, éster de sorbitano y éster de ácido graso de polioxietilensorbitano;

30 - agentes de espolvoreo que se obtienen mediante molienda de los principios activos con sustancias inorgánicas u orgánicas sólidas finamente distribuidas, por ejemplo, talco, arcillas naturales tales como caolín, bentonita y pirofilita, tierra de diatomeas o polvos.

- concentrados de suspensión basados en agua o aceite que se pueden preparar, por ejemplo, mediante molienda y número mediante molinos de perlas;

- polvos solubles en agua;

35 - concentrados solubles en agua;

- granulados tales como granulados solubles en agua, granulados dispersables en agua así como granulados para aplicación de espolvoreo y en suelo;

- polvos de pulverización que aparte del principio activo contienen también diluyentes o sustancias inertes y tensioactivos;

40 - suspensiones de cápsulas y microcápsulas;

- formulaciones de volumen ultra bajo.

45 Los tipos de formulación que se han mencionado anteriormente son conocidos por el experto y se describen, por ejemplo, en: K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3ª Ed., G. Goodwin Ltd., Londres. 1979; W. van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N. Y. 1973; Winacker-Küchler, "Chemische Technologie", Tomo 7, C. Hanser Verlag München, 4ª Edición 1986; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª Ed., McGraw-Hill, N. Y. 1973, páginas 8-57.

50 Los coadyuvantes de formulación necesarios tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos así mismo son conocidos y se describen, por ejemplo, en: McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2ª Ed., Interscience, N. Y. 1963; H. von Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive

Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª Ed., Darland Books, Caldwell N. J.; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Tomo 7, C. Hanser Verlag München, 4ª Edición 1986.

- 5 Además de los coadyuvantes de formulación que se han mencionado anteriormente, los agentes protectores de plantas útiles dado el caso pueden contener agentes adherentes, humectantes, dispersantes, de penetración, emulsionantes, conservantes, anticongelantes, cargas, vehículos y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación así como agentes que influyen en el valor del pH o la viscosidad habituales.

- 10 En función del tipo de la formulación, los agentes protectores de plantas útiles contienen por norma general del 0,1 al 99 % en peso, en particular del 0,2 al 95 % en peso de uno o varios protectores de fórmula general (I) o una combinación de protector y pesticida. Además contienen del 1 al 99,9, en particular del 4 al 99,5 % en peso de uno o varios aditivos sólidos o líquidos y del 0 al 25, en particular del 0,1 al 25 % en peso de un tensioactivo. En concentrados emulsionables, la concentración de principio activo, es decir, la concentración de protector y/o pesticida, por norma general asciende a de 1 al 90, en particular del 5 al 80 % en peso. Los agentes de espolvoreo contienen habitualmente del 1 al 30, preferentemente del 5 al 20 % en peso de principio activo. En polvo de pulverización, la concentración de principio activo asciende por norma general a del 10 al 90 % en peso. En los granulados dispersables en agua, el contenido de principio activo se encuentra, por ejemplo, entre el 1 y el 95 % en peso, preferentemente entre el 10 y el 80 % en peso.

- 20 Para la aplicación, las formulaciones presentes en forma disponible en el mercado dado el caso se diluyen de forma habitual, por ejemplo, en polvos de pulverización, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables con agua, mediante agua. Las preparaciones en forma de polvo, los granulados así como las soluciones pulverizables antes de la aplicación habitualmente ya no se diluyen con otras sustancias inertes. Con las condiciones externas tales como temperatura, humedad, el tipo del herbicida usado, entre otras, varía la dosis de aplicación requerida de los protectores.

- 25 En los siguientes ejemplos, que explican pero no limitan la invención, los datos de cantidades se refieren al peso a menos que se defina de otro modo.

Ejemplos

1 Ejemplos de formulación

1.1 Agente de espolvoreo

- 30 Se obtiene un agente de espolvoreo al mezclar 10 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) o de una mezcla de principios activos de un pesticida (por ejemplo herbicida) y un protector de fórmula (I) y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y al triturar en un molino de impacto.

1.2 Polvo dispersable en agua

- 35 Se obtiene un polvo humectable fácilmente dispersable en agua al mezclar 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) o de una mezcla de principios activos de un pesticida (por ejemplo herbicida) y un protector de fórmula (I), 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de potasio de ácido lignosulfónico y 1 parte en peso de sodio de ácido oleilmetiltaurínico como humectante y dispersante y al moler en un molino de clavijas.

1.3 Concentrado dispersable en agua

- 40 Se obtiene un concentrado de dispersión fácilmente dispersable en agua al mezclar 20 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) o de una mezcla de principios activos de un pesticida (por ejemplo herbicida) y un protector de fórmula (I) con 6 partes en peso de éter de alquilfenolpoliglicol (® Triton X 207), 3 partes en peso de éter de isotridecanopoliglicol y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico y al moler en un molino de bolas de fricción hasta una finura por debajo de 5 micrómetros.

- 45 1.4 Concentrado emulsionable

Se obtiene un concentrado emulsionable a partir de 15 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) o de una mezcla de principios activos de un pesticida (por ejemplo herbicida) y un protector de fórmula (I), 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxetilado como emulsionante.

1.5 Granulado dispersable en agua

- 50 Se obtiene un granulado dispersable en agua al mezclar

75	partes en peso	de un protector de fórmula (I) o de una mezcla de un pesticida y un protector de fórmula (I),
10	partes en peso	de calcio de ácido ligninosulfónico,
5	partes en peso	de laurilsulfato de sodio,
3	partes en peso	de poli(alcohol vinílico) y
7	partes en peso	caolín

al moler en un molino de bolas y al granular el polvo en un lecho fluidizado mediante pulverización de agua como líquido de granulación.

También se obtiene un granulado dispersable en agua al homogeneizar

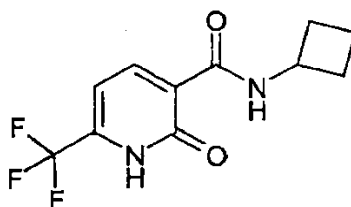
25	partes en peso	de un protector de fórmula (I) o de una mezcla de un pesticida y un protector de fórmula (I),
5	partes en peso	de sodio de ácido 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfónico,
2	partes en peso	de sodio de ácido oleoilmetiltaurínico,
17	partes en peso	de carbonato cálcico,
50	partes en peso	de agua y
1	parte en peso	de poli(alcohol vinílico)

5

al triturar, al moler entonces en un molino de perlas y al pulverizar y secar la suspensión obtenida de este modo en una torre de pulverización mediante una tobera unitaria.

2. Ejemplos de preparación

Ejemplo A1



10

N-ciclobutil-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A1.1) 4-Butoxi-1,1,1-trifluorobut-3-en-2-ona

15 Se mezcló una mezcla de 29,9 g (0,38 mol) de piridina y 50,0 g (0,38 mol) de viniléter de butilo en 200 ml de triclorometano con agitación a 5 °C con 79,9 g (0,38 mol) de anhídrido de ácido trifluoroacético, disuelto en 100 ml de triclorometano. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. La mezcla a continuación se mezcló con 300 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 59 g (79 % del valor teórico) de un aceite amarillento.

RMN de ¹H: [CDCl₃] 0,96 (t, 3H); 1,41 (m, 2H); 1,73 (m, 2H); 4,04 (t, 2H); 5,85 (d, 1 H); 7,90 (d, 1H).

A1.2) Éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

20 Después de la disolución de 2,15 g (94 mmol) de sodio en 300 ml de metanol se añadieron 15,3 g (78 mmol) de 4-butoxi-1,1,1-trifluorobut-3-en-2-ona y 9,13 g (78 mmol) de monoamida de malonato de metilo y la mezcla se calentó a reflujo durante 18 h. Después de la concentración de la mezcla se recogió el residuo en agua y se lavó con diclorometano. A continuación, la fase acuosa mediante adición de ácido clorhídrico 2 N se ajustó a pH 2 y se extrajo con diclorometano. Después del secado y la concentración del extracto quedaron 12 g (69 % del valor teórico) de un polvo incoloro.

25

RMN de ¹H: [CDCl₃] 4,03 (s, 3H); 7,31 (d, 1H); 8,39 (d, 1H).

A1.3) Ácido 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

A temperatura ambiente se disolvieron 4,73 g (21,4 mmol) de éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 45 ml de metanol y 15 ml de agua, se mezclaron con 1,80 g (42,8 mmol) de hidróxido de litio monohidrato y a continuación se calentaron a reflujo durante 2 h. Después de la concentración de la mezcla a aproximadamente 15 ml se lavó con diclorometano y la fase acuosa se ajustó mediante adición de ácido clorhídrico 2 N a pH 2. De nuevo se extrajo con diclorometano, se secó y se concentró la fase orgánica. Se obtuvieron 4,2 g (94 % del valor teórico) de un polvo incoloro.

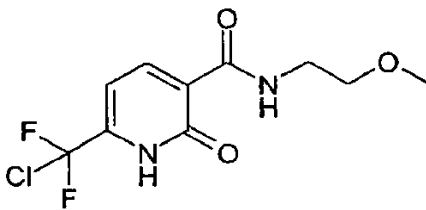
RMN de ^1H : [DMSO] 7,41 (d, 1 H); 8,35 (d, 1 H).

A1.4) N-Ciclobutil-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

Después de la disolución de 600 mg (2,9 mmol) de ácido 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 5 ml de tetrahidrofurano y adición de 658 mg (4,1 mmol) de *N,N*-carbonildiimidazol, en primer lugar se calentó durante 30 min a temperatura ambiente así como durante 30 min a reflujo. A continuación se añadió gota a gota una solución de 247 mg (3,5 mmol) de ciclobutilamina en 5 ml de tetrahidrofurano y se sometió la mezcla a reflujo durante otras 2 h. Después de la concentración de la solución hasta sequedad se recogió en éster de etilo de ácido acético, se lavó con ácido clorhídrico 1 N y agua, se secó y se concentró. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvieron 160 mg (19 % del valor teórico) de un polvo marrón claro.

RMN de ^1H : [CDCl₃] 1,80 (m, 2H); 2,00 (m, 2H); 2,42 (m, 2H); 4,55 (m, 1 H); 6,88 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,50 (a, 1H).

Ejemplo A2



6-[Cloro(difluoro)metil]-N-(2-metoxietil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A2.1) 4-Butoxi-1-cloro-1,1-difluorobut-3-en-2-ona

Una mezcla de 1,60 g (20,2 mol) de piridina y 2,1 g (20,2 mol) de viniléter de butilo en 30 ml de triclorometano se disolvió con agitación a 5 °C con 5,0 g (20,2 mol) de anhídrido de ácido clorodifluoroacético, disuelto en 10 ml de triclorometano. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. La mezcla a continuación se mezcló con 100 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 3,4 g (80 % del valor teórico) de un aceite amarillento.

RMN de ^1H : [DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,35 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 4,20 (t, 2H); 6,04 (d, 1 H); 8,10 (d, 1H).

A2.2) Éster de metilo de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Después de la disolución de 1,47 g (61 mmol) de sodio en 220 ml de metanol se añadieron 10 g (47 mmol) de 4-butoxi-1-cloro-1,1-difluorobut-3-en-2-ona y 5,51 g (47 mmol) de monoamida de malonato de metilo y la mezcla se calentó a reflujo durante 21 h. Mediante adición de ácido clorhídrico 2 N se ajustó a pH 4-5 y a continuación se destilaron aproximadamente 200 ml. La solución permanente se extrajo con éster acético, se secó el extracto y se concentró. El residuo se mezcló con éter de diisopropilo, se aspiró y se secó. Se obtuvieron 7,4 g (66 % del valor teórico) de un polvo incoloro.

RMN de ^1H : [CDCl₃] 4,01 (s, 3H); 7,30 (d, 1H); 8,38 (d, 1H); 11,5 (a, 1H).

A2.3a) Ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Después de la disolución de 1,70 g (74 mmol) de sodio en 250 ml de metanol se añadieron 13,1 g (61,7 mmol) de 4-butoxi-1-cloro-1,1-difluorobut-3-en-2-ona y 7,22 g (61,7 mmol) de monoamida de malonato de metilo y la mezcla se calentó a reflujo durante 21 h. A continuación se añadieron 250 ml de agua y 2,9 g (67,9 mmol) de hidróxido de litio monohidrato y se sometió a reflujo durante otras 2 h. Después de la concentración de la mezcla a aproximadamente 200 ml se lavó con diclorometano y se acidificó la fase acuosa con ácido clorhídrico 2 N a pH 2. Se aspiró el sólido precipitado y se secó al vacío: 9,3 g (68 % del valor teórico).

A2.3b) Ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

11,0 g (49,4 mmol) de 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida se calentaron en 77 ml de ácido sulfúrico al 50 % durante 7 h. A continuación, la mezcla se puso sobre agua helada, se aspiró el precipitado y se

secó. Se obtuvieron 7,2 g (65 % del valor teórico) de un polvo amarillento.

Punto de fusión: 145-147 °C

RMN de ¹H: [DMSO] 7,36 (d, 1H); 8,34 (d, 1H).

A2.4) 6-[Cloro(difluoro)metil]-*N*-(2-metoxietil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

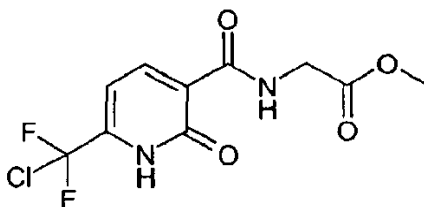
5

Después de la disolución de 500 mg (2,2 mmol) de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 10 ml de tetrahidrofurano y adición de 508 mg (3,1 mmol) de *N,N*-carbonildiimidazol, en primer lugar se calentó durante 30 min a temperatura ambiente así como durante 30 min a reflujo. A continuación se añadió gota a gota una solución de 202 mg (2,7 mmol) de 2-metoxietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano y se sometió a reflujo la mezcla durante otras 2 h. Después de la concentración de la solución hasta sequedad se recogió en éster de etilo de ácido acético, se lavó con ácido clorhídrico 1 N y agua, se secó y se concentró. Se obtuvieron 360 mg (54 % del valor teórico) de un polvo marrón claro.

10

RMN de ¹H: [CDCl₃] 3,40 (s, 3H); 3,58 (m, 2H); 3,67 (m, 2H); 6,84 (d, 1H), 8,62 (d, 1 H); 9,40 (a, 1 H).

Ejemplo A3



15

N-((6-[Cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-il)carbonil)glicinato de metilo

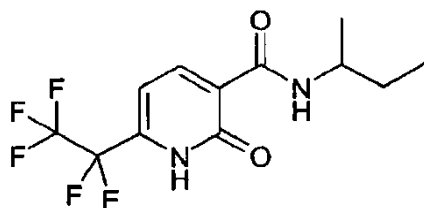
20

Después de la disolución de 300 mg (1,34 mmol) de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 5 ml de tetrahidrofurano y adición de 435 mg (2,68 mmol) de *N,N*-carbonildiimidazol, se calentó en primer lugar durante 30 min a temperatura ambiente así como durante 30 min a reflujo. A continuación se añadió una mezcla de 168 mg (1,34 mmol) de clorhidrato de éster de metilo de glicina en 3 ml de tetrahidrofurano y se sometió la mezcla de reflujo durante otras 2 h. Después de la concentración de la solución hasta la sequedad se recogió en éster de etilo de ácido acético, se lavó con ácido clorhídrico 1 N y agua, se secó y se concentró. Se obtuvieron 92 mg (23 % del valor teórico) de un polvo marrón claro.

RMN de ¹H: [DMSO] 3,65 (s, 3H); 4, 12 (d, 2H); 7,28 (d, a, 1H); 8,42 (d, 1H); 9,25 (t, a, 1H), 13,6 (a, 1H)

25

Ejemplo A4



N-(1-Metilpropil)-2-oxo-6-(pentafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A4.1) 1-Butoxi-4,4,5,5,5-pentafluoropent-1-en-3-ona

30

Una mezcla de 8,11 g (102 mol) de piridina y 9,33 g (93,2 mol) de viniléter de butilo en 200 ml de diclorometano se mezcló con agitación a -10 °C con 17,0 g (93,2 mol) de cloruro de pentafluoropropionilo, disuelto en 20 ml de diclorometano. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. La mezcla se mezcló a continuación con 200 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 18,9 g (82 % del valor teórico) de un aceite amarillento.

RMN de ¹H: [DMSO] 0,85 (t, 3H); 1,32 (m, 2H); 1,63 (m, 2H); 4,20 (t, 2H); 6,06 (d, 1H); 8,11 (d, 1H).

35

A4.2) Éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(pentafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Después de la disolución de 0,56 g (24,4 mmol) de sodio en 150 ml de etanol se añadieron 5 g (20,3 mmol) de 1-butoxi-4,4,5,5,5-pentafluoropent-1-en-3-ona y 2,66 g (20,3 mmol) de monoamida de malonato de metilo y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 h. Después de la concentración de la mezcla a aproximadamente 50 ml se mezcló con

500 ml de ácido clorhídrico 1 N y a continuación se extrajo con éster de etilo de ácido acético. Después del secado y la concentración se obtuvieron 2,3 g (40 % del valor teórico) de una resina amarillenta.

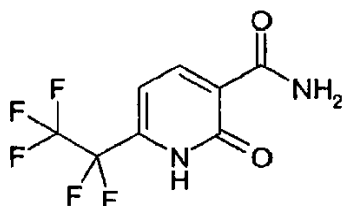
RMN de ^1H : [CDCl_3] 1,45 (t, 3H); 4,50 (c, 2H); 7,35 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 11,4 (a, 1H).

A4.3) *N*-(1-Metilpropil)-2-oxo-6-(pentafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

- 5 Se agitaron 160 mg (0,56 mmol) de éster de etilo de ácido 2-oxo-6-(pentafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico a temperatura ambiente en 5 ml de 2-butilamina durante 14 h. A continuación, mediante la adición de ácido clorhídrico 1 N se ajustó a pH 2, produciéndose un sólido incoloro. Después de la aspiración y del secado se obtuvieron 160 mg (91 % del valor teórico) del producto.

10 RMN de ^1H : [CDCl_3] 0,97 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,59 (m, 2H); 4,10 (m, 1 H); 6,88 (d, 1 H); 8,72 (d, 1H); 9,24 (d, a, 1H); 13,6 (a).

Ejemplo A5

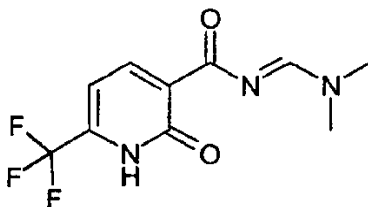


2-Oxo-6-(pentafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

- 15 Después de la disolución de 0,22 g (9,7 mmol) de sodio en 50 ml de etanol se añadieron 2 g (8,1 mmol) de 1-butoxi-4,4,5,5,5-pentafluoropent-1-en-3-ona y 0,86 g (8,1 mmol) de diamida de ácido malónico y se calentó la mezcla durante 7 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla se mezcló con ácido clorhídrico 1 N. El precipitado que se produce a este respecto se aspiró y se secó. Se obtuvieron 1,9 g (94 % del valor teórico) de un polvo amarillento.

RMN de ^1H : [DMSO] 7,45 (d, 1H); 8,15 (a, 1 H); 8,45 (a, 1H); 8,50 (d, 1H); 13,7 (a, 1H).

20 Ejemplo A6



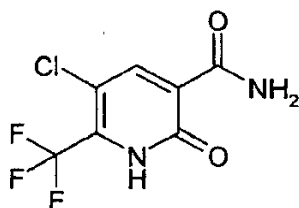
N-[(Dimetilamino)metilen]-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

- 25 Se mezclaron 1,00 mg (4,85 mmol) de 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida en 5 ml de tolueno con 0,87 g (7,28 mmol) de *N,N*-dimetilformamida-dimetilacetal y se calentaron durante 4 h a reflujo. Después del enfriamiento se aspiró el precipitado producido y se secó: 0,5 g (39 % del valor teórico).

RMN de ^1H : [CDCl_3] 3,25 (s, 3H); 3,35 (3, 3H); 7,25 (d, 1 H); 8,58 (d, 1 H); 8,76 (s, 1 H)

RMN de ^{13}C : [CDCl_3] 35 (NMe_2); 106 (C-5); 115 (C-3); 122 (c, CF_3); 143 (C-4); 151 (C-6); 164 (N=CN); 167 (C-2); 171 (CON).

Ejemplo A7



30

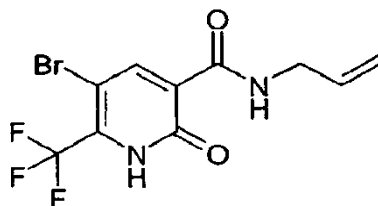
5-Cloro-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

300 mg (1,46 mmol) de 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida en 5 ml de 1,2-dicloroetano y 2,3 g (0,25 ml) de piridina se mezclaron a temperatura ambiente con 0,39 g (2,9 mmol) de cloruro de sulfurilo y a continuación se sometieron durante 2 h a reflujo. La mezcla se puso después sobre ácido clorhídrico 0,5 N. Después de la separación de la fase orgánica, la misma se secó y se concentró, obteniéndose 144 mg (41 % del valor teórico) de un polvo parduzco.

RMN de ^1H : [DMSO] 8,25 (a, 1H); 8,35 (a, 1H); 8,50 (s, 1H); 13,8 (a, 1H)

RMN de ^{13}C : [DMSO] 118 (C-5); 120 (C-6); 120,5 (c, CF_3); 144 (C-4), 161 (C-2); 166 (COONH_2).

Ejemplo A8



10 *N*-Alil-5-bromo-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A8.1) Éster de metilo de ácido 5-bromo-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Una suspensión de 0,3 g (1,36 mmol) de éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 10 ml de ácido acético glacial se mezclaron a temperatura ambiente con 0,36 g (2,04 mmol) de *N*-bromosuccinimida y a continuación se sometieron durante 2 días a reflujo. La mezcla de reacción después se puso sobre agua y se extrajo con diclorometano. Después de la concentración del extracto se realizó la purificación adicional mediante HPLC preparativa. A este respecto se obtuvieron 227 mg (56 % del valor teórico) de un polvo incoloro.

RMN de ^1H : [DMSO] 3,85 (s, 3H); 8,45 (s, 1H); 12,80 (a, 1H);

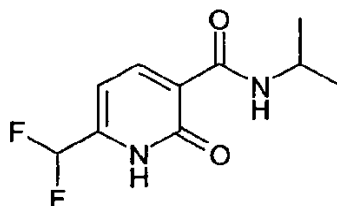
RMN de ^{13}C : [DMSO] 53 (OCH_3); 105 (C-3); 148 (C-4), 161 (C-2); 164 (COOMe).

20 A8.2) *N*-Alil-5-bromo-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

250 mg (0,83 mmol) de 3-carboxilato de metil-5-bromo-2-oxo-6-(trifluorometil)-1,2-dihidropiridina se agitaron a temperatura ambiente en 5 ml de alilamina durante 18 h. A continuación, mediante adición de ácido clorhídrico 2 N se ajustó a pH 2, produciéndose un sólido incoloro. Después de la aspiración y el secado se obtuvieron 134 mg (50 % del valor teórico) del producto.

RMN de ^1H : [DMSO] 3,94 (t, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H).

Ejemplo A9



6-Difluorometil-*N*-isopropil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A9.1) 4-Butoxi-1,1-difluorobut-3-en-2-ona

30 Una mezcla de 4,41 g (4,5 ml, 55,7 mmol) de piridina y 5,7 g (55,7 mmol) de viniléter de butilo en 330 ml de triclorometano se mezcló con agitación a 5 °C con 10,0 g (55,7 mmol) de anhídrido de ácido difluoroacético. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. A continuación, la mezcla se mezcló con 300 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 5,7 g (57 % del valor teórico) de un aceite amarillento.

RMN de ^1H : [CDCl_3] 0,95 (t, 3H); 1,42 (m, 2H); 1,72 (m, 2H); 4,00 (t, 2H); 5,78 (t, 1H); 5,90 (d, 1 H); 7,85 (d, 1 H).

A9.2) Éster de metilo de ácido 6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Después de la disolución de 1,21 g (52,9 mmol) de sodio en 200 ml de metanol se añadieron 7,9 g (44 mmol) de 4-

butoxi-1,1-difluorobut-3-en-2-ona y 5,3 g (44 mmol) de monoamida de malonato de metilo y se calentó la mezcla durante 15 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla se agitó el residuo en 100 ml de ácido clorhídrico 1 N. El sólido obtenido se aspiró y se secó: 7,4 g (82 % del valor teórico).

RMN de ^1H : [DMSO] 3,82 (s, 3H); 6,85 (t, 1H); 7,02 (d, a, 1H); 8,20 (d, 1H); 12,4 (a, 1H).

5 A9.3) Ácido 6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

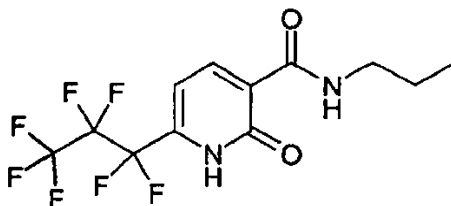
7,4 g (36,4 mmol) de éster de metilo de ácido 6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron en 100 ml de metanol y se mezclaron con una solución de 1,3 g (54,6 mmol) de hidróxido de litio en 50 ml de agua. Después de calentamiento durante dos horas a reflujo se concentró a un volumen de aproximadamente 50 ml y la solución se lavó con diclorometano. A continuación se acidificó la fase acuosa con ácido clorhídrico 2 N y se extrajo con éster de etilo de ácido acético. Después del secado y la concentración del extracto permanecieron 5,6 g (82 % del valor teórico) de un polvo parduzco.

A9.4) 6-(Difluorometil)-*N*-isopropil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

Después de la disolución de 200 mg (1,1 mmol) de ácido 6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 25 ml de tetrahidrofurano y adición de 206 mg (1,3 mmol) de *N,N*-carbonildimidazol se calentó en primer lugar durante 30 min a temperatura ambiente así como durante 30 min a reflujo. A continuación se añadió gota a gota una solución de 66 mg (1,1 mmol) de isopropilamina en 5 ml de tetrahidrofurano y se sometió la mezcla a reflujo durante otras 2 h. Después de la concentración de la solución hasta sequedad se recogió un éster de etilo de ácido acético, se lavó con ácido clorhídrico 2 N y agua, se secó y se concentró. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvieron 150 mg (61 % del valor teórico) de un polvo incoloro.

20 RMN de ^1H : [CDCl₃] 1,25 (d, 6H); 4,22 (m, 1H); 6,55 (t, 1H); 6,69 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,42 (d, a, 1H); 13,0 (a, 1H).

Ejemplo A10



6-(Heptafluoropropil)-2-oxo-*N*-propil-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A10.1) 1-Butoxi-4,4,5,5,6,6,6-heptafluorohex-1-en-3-ona

25 Una mezcla de 8,11 g (102 mmol) de piridina y 9,33 g (93,2 mmol) de viniléter de butilo en 200 ml de diclorometano se mezcló con agitación a -10 °C con 21,7 g (93,2 mmol) de cloruro de heptafluorobutirilo disuelto en 50 ml de diclorometano. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. A continuación, la mezcla se mezcló con 300 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 28,2 g (82 % del valor teórico) de un aceite amarillento que se continuó haciendo reaccionar sin purificación adicional.

30 RMN de ^1H : [CDCl₃] 0,96 (t, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,75 (m, 2H); 4,04 (t, 2H); 5,95 (d, 1H); 7,93 (d, 1H).

A10.2) Éster de metilo de ácido 6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Después de la disolución de 2,63 g (114 mmol) de sodio en 250 ml de metano se añadieron 28,2 g (95,5 mmol) de 1-butoxi-4,4,5,5,6,6,6-heptafluorohex-1-en-3-ona y 11,18 g (95,5 mmol) de monoamida de malonato de metilo y se calentó la mezcla durante 18 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla se recogió el residuo en agua y se lavó con diclorometano. La fase acuosa se ajustó a continuación mediante adición de ácido clorhídrico 2 N a pH 2 y se extrajo con diclorometano. Después del secado, la concentración y la purificación mediante cromatografía en columna del extracto permanecieron 15,2 g (49 % del valor teórico) de un polvo amarillo.

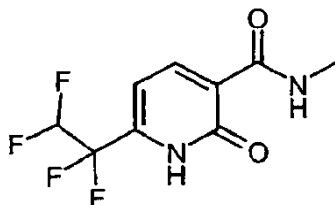
35 RMN de ^1H : [CDCl₃] 4,06 (s, 3H); 7,35 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 11,4 (a, 1H).

40 A10.3) 6-(Heptafluoropropil)-2-oxo-*N*-propil-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

En 5 ml de propilamina se sometieron a reflujo 250 mg (0,78 mmol) de 3-carboxilato de metil-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridina. A continuación se ajustó mediante adición de ácido clorhídrico 1 N a pH 2 y se extrajo una mezcla con diclorometano. Después del secado y la concentración se obtuvieron 240 mg (88 % del valor teórico) de un polvo beige.

45 RMN de ^1H : [DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,54 (m, 2H); 3,25 (c, 2H); 7,41 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,85 (a, 1H); 13,45 (a, 1H).

Ejemplo A11



N-Metil-2-oxo-6-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A11.1) 1-Butoxi-4,4,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona

- 5 Una mezcla de 14,4 g (182 mmol) de piridina y 15,2 g (152 mmol) de viniléter de butilo en 250 ml de diclorometano se mezcló con agitación a 0 °C con 25,0 g (152 mmol) de cloruro de 3H-tetra-fluoropropionilo disuelto en 20 ml de diclorometano. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. A continuación, la mezcla se mezcló con 250 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 15,52 g (36 % del valor teórico) de un aceite amarillento.

10 RMN de ^1H : [CDCl_3] 0,96 (t, 3H); 1,46 (m, 2H); 1,75 (m, 2H); 4,03 (t, 2H); 6,00 (d, 1H); 6,09 (tt, 1H); 7,90 (d, 1 H).

A11.2) Éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

- Después de la disolución de 1,39 g (60,3 mmol) de sodio en 500 ml de metanol se añadieron 11,5 g (50,3 mmol) de 1-butoxi-4,4,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona y 6,07 g (50,3 mmol) de monoamida de malonato de metilo y se calentó la mezcla durante 6 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla a aproximadamente 100 ml se mezcló con 15 500 ml de ácido clorhídrico 1 N y a continuación se extrajo con éster de etilo de ácido acético. Después del secado y la concentración se obtuvieron 10,3 g (67 % del valor teórico) de una resina amarillenta.

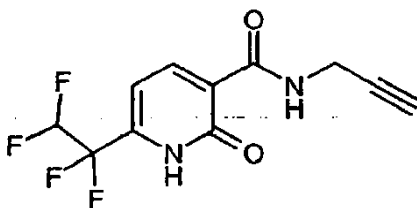
RMN de ^1H : [CDCl_3] 4,03 (s, 3H); 6,40 (tt, 1 H); 7,38 (d, 1 H); 8,39 (d, 1 H).

A11.3) *N*-Metil-2-oxo-6-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

- 20 300 mg (1,19 mmol) de éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se agitaron a temperatura ambiente en 3,3 ml de solución acuosa al 40 % de metilamina durante 14 h. A continuación se ajustó mediante adición de ácido clorhídrico 1 N a pH 2 y se extrajo con diclorometano. Después del secado y la concentración del extracto se obtuvieron 230 mg (77 % del valor teórico) del producto.

RMN de ^1H : [DMSO] 2,83 (d, 3H); 6,81 (tt, 1H); 7,22 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,00 (a, 1 H); 13,4 (a, 1H).

Ejemplo A12

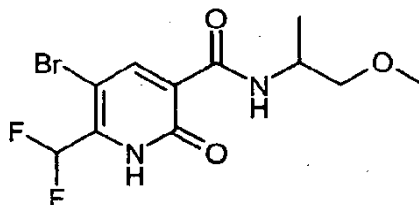


- 25 2-Oxo-*N*-(2-propinil)-6-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

- 30 300 mg (1,19 mmol) de éster de metilo de ácido 2-oxo-6-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se agitaron a temperatura ambiente en 3,3 ml (41 mmol) de propargilamina durante 14 h. A continuación se ajustó mediante adición de ácido clorhídrico 1 N a pH 2 y se extrajo con diclorometano. Después del secado y la concentración del extracto se obtuvieron 280 mg (85 % del valor teórico) del producto.

RMN de ^1H : [DMSO] 3,15 (t, 1H); 4,13 (m, 2H); 6,82 (tt, 1H); 7,18 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 13,3 (a, 1H).

Ejemplo A13



5-Bromo-6-(difluorometil)-N-(2-metoxi-1-metiletil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A13.1) Éster de metilo de ácido 5-bromo-6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

5 4,1 g (20 mmol) de éster de metilo de ácido 6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron en 20 ml de *N,N*-dimetilformamida y se mezclaron a temperatura ambiente con 5,35 g (30 mmol) de *N*-bromosuccinimida. Después de agitación durante 2 horas se puso la mezcla de reacción sobre agua y se extrajo con éter de *tert*-butil-metilo. El extracto a continuación se lavó varias veces con agua. Después del secado y la concentración se obtuvieron finalmente 3,7 g (65 % del valor teórico) del producto.

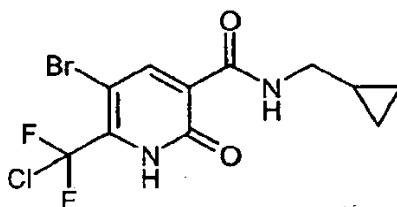
10 RMN de ^1H : [DMSO] 3,83 (s, 3H); 7,07 (t, 1H); 8,34 (s, 1H); 12,5 (s, a, 1H).

A13.2) 5-Bromo-6-(difluorometil)-N-(2-metoxi-1-metiletil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

15 334 mg (1,19 mmol) de éster de metilo de ácido 5-bromo-6-(difluorometil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se agitaron a temperatura ambiente en 3,3 ml (41 mmol) de 2-amino-1-metoxipropano durante 14 h. A continuación se ajustó mediante adición de ácido clorhídrico 1 N a pH 2 y se extrajo con diclorometano. Después del secado y la concentración de extractos se obtuvieron 360 mg (89 % del valor teórico) del producto.

RMN de ^1H : [CDCl₃] 1,27 (d, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,43 (m, 2H); 4,37 (m, 1 H); 6,85 (t, 1 H); 8,68 (s, 1H); 9,42 (d, a, 1H); 12,7 (a, 1H).

Ejemplo A14



20

5-Bromo-6-[cloro(difluoro)metil]-N-(ciclopropilmetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A14.1) Éster de metilo de ácido 5-bromo-6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

25 1,30 g (5,47 mmol) de éster de metilo de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-carboxílico se disolvieron en 50 ml de *N,N*-dimetilformamida y se mezclaron a temperatura ambiente con 1,46 g (8,21 mmol) de *N*-bromosuccinimida. Después de agitación durante 3 horas se puso la mezcla de reacción sobre agua, produciéndose un precipitado incoloro. Después de la aspiración y el secado permanecieron 1,23 g (71 % del valor teórico) del producto.

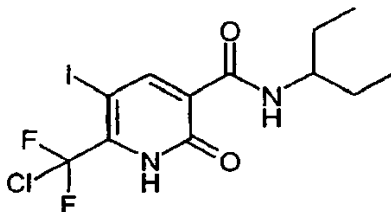
RMN de ^1H : [DMSO] 3,85 (s, 3H); 8,45 (s, 1H); 12,7 (s, a, 1H).

A14.2) 5-Bromo-6-[cloro(difluoro)metil]-N-(ciclopropilmetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

30 350 mg (1,11 mmol) de éster de metilo de ácido 5-bromo-6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron a temperatura ambiente en 5 ml de acetonitrilo y se agitaron con 0,5 ml de aminometilciclopropano durante 12 h. A continuación se puso la mezcla de reacción sobre ácido clorhídrico 1 N y se aspiró el precipitado producido a este respecto. Después de su secado se agitó de nuevo con ácido clorhídrico 1 N, se aspiró y se volvió a lavar con agua. Después del secado se obtuvieron 240 mg (62 % del valor teórico) del producto.

35 RMN de ^1H : [DMSO] 0,25 (m, 2H); 0,46 (m, 2H); 1,04 (m, 1H); 3,20 (t, 2H); 8,55 (s, 1 H); 8,82 (t, a, 1 H); 13,6 (a, 1 H).

Ejemplo A15



6-[Cloro(difluoro)metil]-N-(1-etilpropil)-5-yodo-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

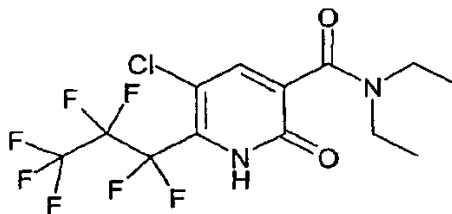
A15.1) Éster de metilo de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-5-yodo-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

- 5 10,0 g (42,1 mmol) de éster de metilo de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron en 50 ml de *N,N*-dimetilformamida y se mezclaron a temperatura ambiente con 6,32 g (63,1 mmol) de carbonato de calcio y 20,5 g (126 mmol) de cloruro de yodo. Después de agitación durante 6 horas a 50 °C se puso la mezcla de reacción sobre agua, reduciéndose un precipitado incoloro que se lavó con solución diluida de bisulfito sódico y agua. Después de la aspiración y el secado permanecieron 13,6 g (89 % del valor teórico) del producto.
- 10 RMN de ¹H: [DMSO] 3,84 (s, 3H); 8,61 (s, 1H); 12,6 (s, a, 1H).

A15.2) 6-[Cloro(difluoro)metil]-N-(1-etilpropil)-5-yodo-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

- 400 mg (1,1 mmol) de éster de metilo de ácido 6-[cloro(difluoro)metil]-5-yodo-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron a temperatura ambiente en 5 ml de acetonitrilo y se agitaron con 0,5 ml de 3-pentilamina durante 12 h. A continuación se puso la mezcla de reacción sobre ácido clorhídrico 1 N, se aspiró el precipitado producido a este respecto y se lavó con agua. Después del secado se obtuvieron 370 mg (72 % del valor teórico) del producto.
- 15 RMN de ¹H: [DMSO] 0,87 (t, 6H); 1,43 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,78 (m, 1H); 8,55 (a, 1 H); 8,67 (s, 1 H); 13,5 (a, 1 H).

Ejemplo A16



5-Cloro-N,N-dietil-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A16.1) Éster de metilo de ácido 5-cloro-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

- 16,7 g (52 mmol) de éster de metilo 6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron en 160 ml de *N,N*-dimetilformamida y se mezclaron a temperatura ambiente con 7,08 g (52 mmol) de *N*-clorosuccinimida. Después de agitación durante 3 horas a 50 °C se puso la mezcla de reacción sobre agua y se extrajo varias veces con éster de etilo de ácido acético. A continuación se separó la fase orgánica, se lavó con agua y se secó. Después, el producto en bruto obtenido se purificó mediante RP-HPLC preparativa. Se obtuvieron 10,1 g (54 % del valor teórico) del producto en forma de polvo incoloro.
- 25 RMN de ¹H: [DMSO] 3,85 (s, 3H); 8,35 (s, 1H); 12,8 (s, a, 1H).

A16.2) Ácido 5-cloro-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

- 1,54 g (4,33 mmol) de éster de metilo de ácido 5-cloro-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se disolvieron en 23 ml de metanol y se mezclaron con una solución de 0,16 g (6,5 mmol) de hidróxido de litio en 13 de agua. Después de calentamiento durante 2 horas a reflujo se destiló en metanol y la solución acuosa remanente se lavó con diclorometano. A continuación se acidificó la fase acuosa con ácido clorhídrico 2 N y se extrajo con diclorometano. Después del secado y la concentración del extracto permanecieron 1,45 g (98 % del valor teórico) de un polvo parduzco.
- 30 RMN de ¹H: [DMSO] 8,30 (s, 1H).

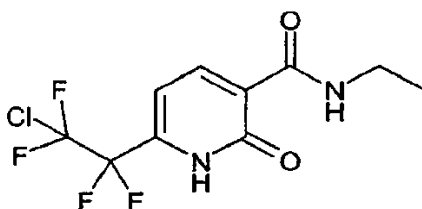
A16.3) 5-Cloro-N,N-dietil-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

Después de la disolución de 355 mg (1,04 mmol) de ácido 5-cloro-6-(heptafluoropropil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-

carboxílico en 30 ml de tetrahidrofurano y adición de 337 mg (2,08 mmol) de *N,N*-carbonildiimidazol se calentó en primer lugar durante 30 min a temperatura ambiente así como durante 30 min a reflujo. A continuación se añadieron 152 mg (0,22 ml, 2,08 mmol) de dietilamina y se sometió la mezcla a reflujo durante otras 2 h. Después de la concentración de la solución hasta sequedad se recogió en diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico 1 N y agua, se secó y se concentró. Se obtuvieron 300 mg (72 % del valor teórico) del producto.

RMN de ^1H : [DMSO] 1,03 (t, 3H); 1,15 (t, 3H); 3,12 (c, 2H); 3,45 (c, 2H); 8,05 (s, 1H); 12,5 (a, 1H).

Ejemplo A17



6-(2-Cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-*N*-etil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

10 A17.1) 1-Butoxi-5-cloro-4,4,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona

Una mezcla de 3,97 g (50,2 mmol) de piridina y 5,03 g (50,2 mmol) de viniléter de butilo en 80 ml de cloroformo se mezcló con agitación a 0 °C con 10,0 g (50,2 mmol) de cloruro de 3-clorotetrafluoropropionilo disuelto en 20 ml de cloroformo. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. A continuación, la mezcla se mezcló con 100 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 10,4 g (78 % del valor teórico) de un aceite amarillento.

$^1\text{H-NMR}$: [CDCl_3] 0,96 (t, 3H); 1,43 (m, 2H); 1,75 (m, 2H); 4,04 (t, 2H); 5,97 (d, 1H); 7,91 (d, 1H).

A17.2) Éster de metilo de ácido 6-(2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico

Después de la disolución de 0,32 g (13,7 mmol) de sodio en 50 ml de metanol se añadieron 3,0 g (11,4 mmol) de 1-butoxi-5-cloro-4,4,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona y 1,34 g (11,4 mmol) de monoamida de malonato de metilo y se calentó la mezcla durante 6 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla a aproximadamente 30 ml se mezcló con 50 ml de ácido clorhídrico 1 N y a continuación se extrajo varias veces con éster de etilo de ácido acético. Después del secado y la concentración se recogió el residuo obtenido en éter de dietilo y se filtró. Después de la concentración del filtrado se obtuvieron 1,74 g (52 % del valor teórico) de un polvo amarillento.

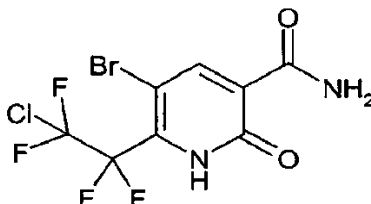
RMN de ^1H [DMSO] 3,84 (s, 3H); 7,44 (d, 1H); 8,32 (d, 1H); 12,4 (a, 1H).

25 A17.3) 6-(2-Cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-*N*-etil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

300 mg (1,04 mmol) de éster de metilo de ácido 6-(2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico se agitaron a temperatura ambiente en 5 ml de solución acuosa de etilamina (70 %) durante 14 h. A continuación se ajustó mediante adición de ácido clorhídrico 1 N a pH 2 y se extrajo con diclorometano. Después del secado y la concentración del extracto se obtuvieron 310 (98 % del valor teórico) del producto.

RMN de ^1H : [CDCl_3] 1,27 (t, 3H); 3,50 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,68 (d, 1 H); 9,32 (a, 1H); 12,6 (a, 1 H).

Ejemplo A18



5-Bromo-6-(2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A18.1) 6-(2-Cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

35 Después de la disolución de 0,53 g (22,8 mmol) de sodio en 50 ml de metanol se añadieron 5,0 g (19,0 mmol) de 1-butoxi-5-cloro-4,4,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona y 2,0 g (19,0 mmol) de diamida de ácido malónico y se sometió la mezcla durante 6 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla se mezcló con ácido clorhídrico 1 N. El precipitado producido a este respecto se aspiró y se secó. Se obtuvieron 3,8 g (73 % del valor teórico) de un polvo

parduzco.

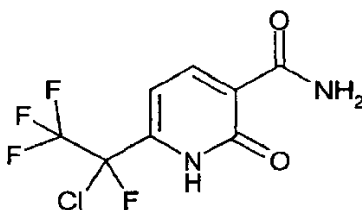
RMN de ^1H : [DMSO] 7,42 (a, 1H); 8,10 (a, 1H); 8,40 (a, 1H); 8,46 (d, 1H), 13,6 (a, 1 H).

A18.2) 5-Bromo-6-(2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

5 0,49 g (1,8 mmol) de 6-(2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida se disolvieron en 5 ml de *N,N*-dimetilformamida y se mezclaron a temperatura ambiente y con 0,48 g (2,7 mmol) de *N*-bromosuccinimida. Después de agitación durante 2 horas a temperatura ambiente se puso la mezcla de reacción sobre agua, produciéndose un precipitado. Después de la aspiración, lavado con agua y secado se obtuvieron 610 mg (96 % del valor teórico) del producto en forma de polvo amarillento.

RMN de ^1H : [DMSO] 8,25 (a, 1 H); 8,35 (a, 1H); 8,61 (s, 1H); 13,7 (a, 1H).

10 Ejemplo A19



6-(1-Cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

A19.1) 1-Butoxi-4-cloro-4,5,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona

15 Una mezcla de 4,19 g (50,0 mmol) de piridina y 4,83 g (48,2 mmol) de viniléter de butilo en 75 ml de diclorometano se mezcló con agitación a 0 °C gota a gota con 9,59 g (48,2 mmol) de cloruro de 2-clorotetrafluoropropionilo. Después de la adición se continuó agitando todavía durante 15 h a temperatura ambiente. A continuación, la mezcla se lavó con ácido clorhídrico 1 N y 2 x 100 ml de agua, se separó la fase orgánica, se secó y se concentró. Se obtuvieron 6,33 g (50 % del valor teórico) de un aceite marrón.

RMN de ^1H : [CDCl₃] 0,97 (t, 3H); 1,48 (m, 2H); 1,75 (m, 2H); 4,03 (t, 2H); 5,98 (d, 1H); 7,89 (d, 1H).

20 A19.2) 6-(1-Cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida

25 Después de la disolución de 0,33 g (14,4 mmol) de sodio en 50 ml de metanol se añadieron 3,16 g (12,03 mmol) de 1-butoxi-4-cloro-4,5,5,5-tetrafluoropent-1-en-3-ona y 1,27 g (12,03 mmol) de diamida de ácido malónico y se calentó la mezcla durante 7 h a reflujo. Después de la concentración de la mezcla se mezcló con ácido clorhídrico 1 N. El precipitado producido a este respecto se aspiró y se secó. Se obtuvieron 380 mg (12 % del valor teórico) de un polvo amarillento.

RMN de ^1H : [DMSO] 7,45 (d, 1 H); 8,14 (a, 1 H); 8,42 (a, 1 H); 8,48 (d, 1 H); 13,7 (a, 1H).

En la siguiente tabla 1 está indicada a modo de ejemplo una serie de compuestos de fórmula general (I) que se pueden obtener de forma análoga a los anteriores ejemplos A1 a A10 y los procedimientos que se han mencionado anteriormente.

30 En la tabla significan:

Bu	=	butilo	Et	=	etilo
Me	=	metilo	Ph	=	fenilo
Pr	=	propilo			
i	=	iso	s	=	secundario
t	=	terciario	c	=	ciclo

Los correspondiente se aplica a las expresiones compuestas tales como

iPr	=	isopropilo
iBu	=	isobutilo

sBu	=	sec-butilo
tBu	=	terc-butilo
cPr	=	ciclopropilo
cpentilo	=	ciclopentilo
chexilo	=	ciclohexilo

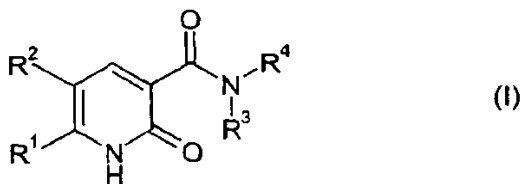
Si en las tablas está indicado un resto alquilo sin otra indicación, entonces se trata del resto alquilo de cadena lineal, es decir, por ejemplo Bu = n-Bu = n-butilo.

5 Los índices numéricos en las expresiones de las fórmulas en la tabla no están en subíndice, sino que están dispuestos a la misma altura de línea y tamaño de fuente que los símbolos atómicos.

Por ejemplo, la fórmula CF3 en la tabla se corresponde con la fórmula CF₃ de acuerdo con la anotación habitual con índice en subíndice o la fórmula CH₂CH(CH₂CH₃)₂, con la fórmula CH₂CH(CH₂CH₃)₂ con índices en subíndice.

10 En cuanto a algunos compuestos (I) en la tabla 1 están indicados en la tabla 2 datos físico químicos (por norma general, datos de RMN de ¹H). A este respecto, la asignación de los datos a los compuestos se realiza a través del número de ejemplo de acuerdo con la tabla 1.

Tabla 1. Compuestos de fórmula (I)



Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1	CF3	H	H	Me
2	CF3	H	H	Et
3	CF3	H	H	Pr
4	CF3	H	H	iPr
5	CF3	H	H	cPr
6	CF3	H	H	Bu
7	CF3	H	H	cBu
8	CF3	H	H	tBu
9	CF3	H	Me	Me
10	CF3	H	Me	Et
11	CF3	H	Me	Bu
12	CF3	H	Me	Pr
13	CF3	H	Me	iPr
14	CF3	H	Et	Et
15	CF3	H	Et	Pr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
16	CF ₃	H	Et	iPr
17	CF ₃	H	Pr	Pr
18	CF ₃	H	H	cpentilo
19	CF ₃	H	H	chexilo
20	CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
21	CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
22	CF ₃	H	H	CH ₂ -cPr
23	CF ₃	H	H	CH ₂ -CN
24	CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
25	CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
26	CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
27	CF ₃	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
28	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
29	CF ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
30	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
31	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
32	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
33	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
34	CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
35	CF ₃	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
36	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
37	CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
38	CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
39	CF ₃	H	H	CH ₂ -C≡CH
40	CF ₃	H	Me	CH ₂ -C≡CH
41	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
42	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)cPr
43	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
44	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
45	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
46	CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
47	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
48	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
49	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
50	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
51	CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
52	CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
53	CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
54	CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
55	CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
56	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
57	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
58	CF ₃	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
59	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
60	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
61	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
62	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
63	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
64	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
65	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
66	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
67	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
68	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
69	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
70	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
71	CF ₃	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
72	CF ₃	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
73	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOMe
74	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOEt
75	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
76	CF ₃	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
77	CF ₃	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
78	CF ₃	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
79	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₃
80	CF ₃	H	Me	O-CH ₃
81	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
82	CF ₃	H	H	O-tBu
83	CF ₃	H	H	O-Pr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
84	CF ₃	H	H	O-CH ₂ cPr
85	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
86	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CF ₃
87	CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
88	CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
89	CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CH
90	CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
91	CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
92	CF ₃	H	H	CH ₂ -Ph
93	CF ₃	H	Me	CH ₂ -Ph
94	CF ₃	H	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
95	CF ₃	H	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
96	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)Ph
97	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
98	CF ₃	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
99	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
100	CF ₃	H		morfolin-4-ilo
101	CF ₃	H		piperidin-1-ilo
102	CF ₃	H		tiazolidin-3-ilo
103	CF ₃	H		pirrolidin-1-ilo
104	CF ₃	H		2-metil-pirrolidin-1-ilo
105	CF ₃	H		=CH-N(CH ₃) ₂
106	CF ₃	H		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
107	CF ₃	H		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
108	CF ₃	H		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
109	CF ₃	H		=CH-piperidina
110	CF ₃	H		=CH-morfolina
111	CF ₃	H		=CH-pirrolidina
112	CF ₃	H	H	indan-1-ilo
113	CF ₃	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
114	CF ₂ Cl	H	H	H
115	CF ₂ Cl	H	H	Me
116	CF ₂ Cl	H	H	Et
117	CF ₂ Cl	H	H	Pr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
118	CF ₂ Cl	H	H	iPr
119	CF ₂ Cl	H	H	cPr
120	CF ₂ Cl	H	H	Bu
121	CF ₂ Cl	H	H	cBu
122	CF ₂ Cl	H	H	tBu
123	CF ₂ Cl	H	Me	Me
124	CF ₂ Cl	H	Me	Et
125	CF ₂ Cl	H	Me	Bu
126	CF ₂ Cl	H	Me	Pr
127	CF ₂ Cl	H	Me	iPr
128	CF ₂ Cl	H	Et	Et
129	CF ₂ Cl	H	Et	Pr
130	CF ₂ Cl	H	Et	iPr
131	CF ₂ Cl	H	Pr	Pr
132	CF ₂ Cl	H	H	cpentilo
133	CF ₂ Cl	H	H	chexilo
134	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
135	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
136	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -cPr
137	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CN
138	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
139	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
140	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
141	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
142	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
143	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
144	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
145	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
146	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
147	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
148	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
149	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
150	CF ₂ Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
151	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
152	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
153	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C≡CH
154	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -C=CH
155	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
156	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)cPr
157	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
158	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
159	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
160	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
161	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
162	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
163	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
164	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
165	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
166	CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
167	CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
168	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
169	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
170	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
171	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
172	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
173	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
174	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
175	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
176	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
177	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
178	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
179	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
180	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
181	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
182	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
183	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
184	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
185	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -COOCH ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
186	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
187	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOMe
188	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOEt
189	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
190	CF ₂ Cl	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
191	CF ₂ Cl	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
192	CF ₂ Cl	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
193	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₃
194	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₃
195	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
196	CF ₂ Cl	H	H	O-tBu
197	CF ₂ Cl	H	H	O-Pr
198	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ cPr
199	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
200	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CF ₃
201	CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
202	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
203	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CH
204	CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
205	CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
206	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -Ph
207	CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -Ph
208	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
209	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
210	CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)Ph
211	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
212	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
213	CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
214	CF ₂ Cl	H		morfolin-4-ilo
215	CF ₂ Cl	H		piperidin-1-ilo
216	CF ₂ Cl	H		tiazolidin-3-ilo
217	CF ₂ Cl	H		pirrolidin-1-ilo
218	CF ₂ Cl	H		2-metil-pirrolidin-1-ilo
219	CF ₂ Cl	H		=CH-N(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
220	CF ₂ Cl	H		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
221	CF ₂ Cl	H		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
222	CF ₂ Cl	H		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
223	CF ₂ Cl	H		=CH-piperidina
224	CF ₂ Cl	H		=CH-morfolina
225	CF ₂ Cl	H		=CH-pirrolidina
226	CF ₂ Cl	H	H	indan-1-ilo
227	CF ₂ Cl	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
228	CHF ₂	H	H	H
229	CHF ₂	H	H	Me
230	CHF ₂	H	H	Et
231	CHF ₂	H	H	Pr
232	CHF ₂	H	H	iPr
233	CHF ₂	H	H	cPr
234	CHF ₂	H	H	Bu
235	CHF ₂	H	H	cBu
236	CHF ₂	H	H	tBu
237	CHF ₂	H	Me	Me
238	CHF ₂	H	Me	Et
239	CHF ₂	H	Me	Bu
240	CHF ₂	H	Me	Pr
241	CHF ₂	H	Me	iPr
242	CHF ₂	H	Et	Et
243	CHF ₂	H	Et	Pr
244	CHF ₂	H	Et	iPr
245	CHF ₂	H	Pr	Pr
246	CHF ₂	H	H	cpentilo
247	CHF ₂	H	H	chexilo
248	CHF ₂	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
249	CHF ₂	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
250	CHF ₂	H	H	CH ₂ -cPr
251	CHF ₂	H	H	CH ₂ -CN
252	CHF ₂	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
253	CHF ₂	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
254	CHF2	H	H	CH2CF3
255	CHF2	H	H	CH2(CF2)2CF3
256	CHF2	H	H	CH2CH(CH3)CH2CH3
257	CHF2	H	H	CH2C(CH3)2CH2F
258	CHF2	H	H	CH2CH(CH3)2
259	CHF2	H	H	CH2CH(CH2CH3)2
260	CHF2	H	H	CH2CH2CH(CH3)2
261	CHF2	H	H	CH2CH2C(CH3)3
262	CHF2	H	H	CH2CH=CH2
263	CHF2	H	Me	CH2CH=CH2
264	CHF2	H	CH2CH=CH2	CH2CH=CH2
265	CHF2	H	H	CH2CH=CHCH3
266	CHF2	H	H	CH2-C(CH3)=CH2
267	CHF2	H	H	CH2-C=CH
268	CHF2	H	Me	CH2-C=CH
269	CHF2	H	H	CH(CH3)CH2CH3
270	CHF2	H	H	CH(CH3)cPr
271	CHF2	H	H	CH(CH3)(CH2)2CH3
272	CHF2	H	H	CH(CH3)(CH2)4CH3
273	CHF2	H	H	CH(CH3)(CH2)5CH3
274	CHF2	H	H	CH(CH2CH3)(CH2)3CH3
275	CHF2	H	H	CH(CH3)CH2CH(CH3)2
276	CHF2	H	H	CH(CH3)C(CH3)3
277	CHF2	H	H	CH(CH3)CH(CH3)2
278	CHF2	H	H	CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)2
279	CHF2	H	H	CH(CH2CH3)2
280	CHF2	H	H	C(CH3)2CH2CH3
281	CHF2	H	H	C(CH3)2CH2C(CH3)3
282	CHF2	H	H	CH2-CH(OMe)2
283	CHF2	H	H	CH2-CH(OEt)2
284	CHF2	H	H	CH2CH2-OH
285	CHF2	H	H	CH2CH2-OMe
286	CHF2	H	H	CH2CH2-OEt
287	CHF2	H	H	CH2CH2-SMe

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
288	CHF2	H	H	CH2CH2-CN
289	CHF2	H	H	CH2CH2-NMe2
290	CHF2	H	H	CH2CH2-morfolin-4-ilo
291	CHF2	H	H	CH(CH3)CH2-OMe
292	CHF2	H	H	CH(CH3)CH2-NMe2
293	CHF2	H	H	CH2CH2CH2-OMe
294	CHF2	H	H	CH2CH2CH2-SMe
295	CHF2	H	H	CH2CH2CH2-OEt
296	CHF2	H	H	CH2CH2CH2-OiPr
297	CHF2	H	H	CH2CH2CH2-OBu
298	CHF2	H	H	CH2-COOCH3
299	CHF2	H	Me	CH2-COOCH3
300	CHF2	H	H	CH(CH3)COOMe
301	CHF2	H	H	CH(CH3)COOEt
302	CHF2	H	H	CH2CH2-COOCH3
303	CHF2	H	H	CH(COOCH3)2
304	CHF2	H	H	CH(COOEt)CH2-CH(CH3)2
305	CHF2	H	H	CH(COOMe)CH(CH3)2
306	CHF2	H	H	O-CH2CH3
307	CHF2	H	H	O-CH3
308	CHF2	H	H	O-CH2CH=CH2
309	CHF2	H	H	O-tBu
310	CHF2	H	H	O-Pr
311	CHF2	H	H	O-CH2cPr
312	CHF2	H	H	O-CH2CH(CH3)2
313	CHF2	H	H	O-CH2CF3
314	CHF2	H	H	O-CH(CH3)cPr
315	CHF2	H	H	O-CH2CH2Cl
316	CHF2	H	H	O-CH2C≡CH
317	CHF2	H	H	O-CH2C≡CCH3
318	CHF2	H	H	O-CH(CH3)C≡CH
319	CHF2	H	H	CH2-Ph
320	CHF2	H	Me	CH2-Ph
321	CHF2	H	H	CH2-piridin-3-ilo

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
322	CHF2	H	H	CH2-6-Cl-piridin-3-ilo
323	CHF2	H	H	CH(CH3)Ph
324	CHF2	H	H	CH2CH2-Ph
325	CHF2	H	H	CH2-2-CF3-Ph
326	CHF2	H	H	CH2CH2CHPh
327	CHF2	H		morfolin-4-ilo
328	CHF2	H		piperidin-1-ilo
329	CHF2	H		tiazolidin-3-ilo
330	CHF2	H		pirrolidin-1-ilo
331	CHF2	H		2-metil-pirrolidin-1-ilo
332	CHF2	H		=CH-N(CH3)2
333	CHF2	H		=C(CH3)N(CH3)2
334	CHF2	H		=CH-N(C2H5)2
335	CHF2	H		=C(CH3)N(C2H5)2
336	CHF2	H		=CH-piperidina
337	CHF2	H		=CH-morfolina
338	CHF2	H		=CH-pirrolidina
339	CHF2	H	H	indan-1-ilo
340	CHF2	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
341	CF2CF3	H	H	H
342	CF2CF3	H	H	Me
343	CF2CF3	H	H	Et
344	CF2CF3	H	H	Pr
345	CF2CF3	H	H	iPr
346	CF2CF3	H	H	cPr
347	CF2CF3	H	H	Bu
348	CF2CF3	H	H	cBu
349	CF2CF3	H	H	tBu
350	CF2CF3	H	Me	Me
351	CF2CF3	H	Me	Et
352	CF2CF3	H	Me	Bu
353	CF2CF3	H	Me	Pr
354	CF2CF3	H	Me	iPr
355	CF2CF3	H	Et	Et

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
356	CF ₂ CF ₃	H	Et	Pr
357	CF ₂ CF ₃	H	Et	iPr
358	CF ₂ CF ₃	H	Pr	Pr
359	CF ₂ CF ₃	H	H	cpentilo
360	CF ₂ CF ₃	H	H	chexilo
361	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
362	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
363	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -cPr
364	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -CN
365	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
366	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
367	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
368	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
369	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
370	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
371	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
372	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
373	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
374	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
375	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
376	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
377	CF ₂ CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
378	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
379	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
380	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -C=CH
381	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ -C=CH
382	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
383	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)cPr
384	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
385	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
386	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
387	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
388	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
389	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
390	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
391	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
392	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
393	CF ₂ CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
394	CF ₂ CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
395	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
396	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
397	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
398	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
399	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
400	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
401	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
402	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
403	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
404	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
405	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
406	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
407	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
408	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
409	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
410	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
411	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
412	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
413	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
414	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOMe
415	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)COOEt
416	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
417	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
418	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
419	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
420	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₃
421	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₃
422	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
423	CF ₂ CF ₃	H	H	O-tBu

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
424	CF ₂ CF ₃	H	H	O-Pr
425	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ cPr
426	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
427	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CF ₃
428	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
429	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
430	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CH
431	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
432	CF ₂ CF ₃	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
433	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -Ph
434	CF ₂ CF ₃	H	Me	CH ₂ -Ph
435	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
436	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
437	CF ₂ CF ₃	H	H	CH(CH ₃)Ph
438	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
439	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
440	CF ₂ CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
441	CF ₂ CF ₃	H		morfolin-4-ilo
442	CF ₂ CF ₃	H		piperidin-1-ilo
443	CF ₂ CF ₃	H		tiazolidin-3-ilo
444	CF ₂ CF ₃	H		pirrolidin-1-ilo
445	CF ₂ CF ₃	H		2-metil-pirrolidin-1-ilo
446	CF ₂ CF ₃	H		=CH-N(CH ₃) ₂
447	CF ₂ CF ₃	H		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
448	CF ₂ CF ₃	H		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
449	CF ₂ CF ₃	H		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
450	CF ₂ CF ₃	H		=CH-piperidina
451	CF ₂ CF ₃	H		=CH-morfolina
452	CF ₂ CF ₃	H		=CH-pirrolidina
453	CF ₂ CF ₃	H	H	indan-1-ilo
454	CF ₂ CF ₃	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
455	CF ₃	Cl	H	H
456	CF ₃	Cl	H	Me
457	CF ₃	Cl	H	Et

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
458	CF ₃	Cl	H	Pr
459	CF ₃	Cl	H	iPr
460	CF ₃	Cl	H	cPr
461	CF ₃	Cl	H	Bu
462	CF ₃	Cl	H	cBu
463	CF ₃	Cl	H	tBu
464	CF ₃	Cl	Me	Me
465	CF ₃	Cl	Me	Et
466	CF ₃	Cl	Me	Bu
467	CF ₃	Cl	Me	Pr
468	CF ₃	Cl	Me	iPr
469	CF ₃	Cl	Et	Et
470	CF ₃	Cl	Et	Pr
471	CF ₃	Cl	Et	iPr
472	CF ₃	Cl	Pr	Pr
473	CF ₃	Cl	H	cpentilo
474	CF ₃	Cl	H	chexilo
475	CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
476	CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
477	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -cPr
478	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CN
479	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
480	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
481	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
482	CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
483	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
484	CF ₃	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
485	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
486	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
487	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
488	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
489	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
490	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
491	CF ₃	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

492	CF3	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
493	CF3	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
494	CF3	Cl	H	CH ₂ -C=CH
495	CF3	Cl	Me	CH ₂ -C=CH
496	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
497	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
498	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
499	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
500	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
501	CF3	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
502	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
503	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
504	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
505	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
506	CF3	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
507	CF3	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
508	CF3	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
509	CF3	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
510	CF3	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
511	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
512	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
513	CF3	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
514	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
515	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
516	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -CN
517	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
518	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
519	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
520	CF3	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
521	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
522	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
523	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
524	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
525	CF3	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
526	CF3	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
527	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
528	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
529	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
530	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
531	CF ₃	Cl	H	CH(COOCH ₃) ₂
532	CF ₃	Cl	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
533	CF ₃	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
534	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₃
535	CF ₃	Cl	Me	O-CH ₃
536	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
537	CF ₃	Cl	H	O-tBu
538	CF ₃	Cl	H	O-Pr
539	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ cPr
540	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
541	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
542	CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
543	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
544	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
545	CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
546	CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
547	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -Ph
548	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -Ph
549	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
550	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
551	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
552	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
553	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
554	CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
555	CF ₃	Cl		morfolin-4-ilo
556	CF ₃	Cl		piperidin-1-ilo
557	CF ₃	Cl		tiazolidin-3-ilo
558	CF ₃	Cl		pirrolidin-1-ilo
559	CF ₃	Cl		2-metil-pirrolidin-1-ilo
560	CF ₃	Cl		=CH-N(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
561	CF ₃	Cl		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
562	CF ₃	Cl		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
563	CF ₃	Cl		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
564	CF ₃	Cl		=CH-piperidina
565	CF ₃	Cl		=CH-morfolina
566	CF ₃	Cl		=CH-pirrolidina
567	CF ₃	Cl	H	indan-1-ilo
568	CF ₃	Cl	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
569	CF ₂ Cl	Cl	H	H
570	CF ₂ Cl	Cl	H	Me
571	CF ₂ Cl	Cl	H	Et
572	CF ₂ Cl	Cl	H	Pr
573	CF ₂ Cl	Cl	H	iPr
574	CF ₂ Cl	Cl	H	cPr
575	CF ₂ Cl	Cl	H	Bu
576	CF ₂ Cl	Cl	H	cBu
577	CF ₂ Cl	Cl	H	tBu
578	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me
579	CF ₂ Cl	Cl	Me	Et
580	CF ₂ Cl	Cl	Me	Bu
581	CF ₂ Cl	Cl	Me	Pr
582	CF ₂ Cl	Cl	Me	iPr
583	CF ₂ Cl	Cl	Et	Et
584	CF ₂ Cl	Cl	Et	Pr
585	CF ₂ Cl	Cl	Et	iPr
586	CF ₂ Cl	Cl	Pr	Pr
587	CF ₂ Cl	Cl	H	cpentilo
588	CF ₂ Cl	Cl	H	chexilo
589	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
590	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
591	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -cPr
592	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CN
593	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
594	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
595	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
596	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
597	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
598	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
599	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
600	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
601	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
602	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
603	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
604	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
605	CF ₂ Cl	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
606	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
607	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
608	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C=CH
609	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -C=CH
610	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
611	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
612	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
613	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
614	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
615	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
616	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
617	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
618	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
619	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
620	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
621	CF ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
622	CF ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
623	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
624	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
625	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
626	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
627	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
628	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OEt

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
629	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
630	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -CN
631	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
632	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
633	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
634	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
635	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
636	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
637	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
638	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
639	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
640	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
641	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
642	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
643	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
644	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
645	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(COOCH ₃) ₂
646	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
647	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
648	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH ₃
649	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₃
650	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
651	CF ₂ Cl	Cl	H	O-tBu
652	CF ₂ Cl	Cl	H	O-Pr
653	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ cPr
654	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
655	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
656	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
657	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
658	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
659	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
660	CF ₂ Cl	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
661	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -Ph
662	CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -Ph

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
663	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
664	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
665	CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
666	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
667	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
668	CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
669	CF ₂ Cl	Cl		morfolin-4-ilo
670	CF ₂ Cl	Cl		piperidin-1-ilo
671	CF ₂ Cl	Cl		tiazolidin-3-ilo
672	CF ₂ Cl	Cl		pirrolidin-1-ilo
673	CF ₂ Cl	Cl		2-metil-pirrolidin-1-ilo
674	CF ₂ Cl	Cl		=CH-N(CH ₃) ₂
675	CF ₂ Cl	Cl		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
676	CF ₂ Cl	Cl		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
677	CF ₂ Cl	Cl		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
678	CF ₂ Cl	Cl		=CH-piperidina
679	CF ₂ Cl	Cl		=CH-morfolina
680	CF ₂ Cl	Cl		=CH-pirrolidina
681	CF ₂ Cl	Cl	H	indan-1-ilo
682	CF ₂ Cl	Cl	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
683	CHF ₂	Cl	H	H
684	CHF ₂	Cl	H	Me
685	CHF ₂	Cl	H	Et
686	CHF ₂	Cl	H	Pr
687	CHF ₂	Cl	H	iPr
688	CHF ₂	Cl	H	cPr
689	CHF ₂	Cl	H	Bu
690	CHF ₂	Cl	H	cBu
691	CHF ₂	Cl	H	tBu
692	CHF ₂	Cl	Me	Me
693	CHF ₂	Cl	Me	Et
694	CHF ₂	Cl	Me	Bu
695	CHF ₂	Cl	Me	Pr
696	CHF ₂	Cl	Me	iPr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
697	CHF2	Cl	Et	Et
698	CHF2	Cl	Et	Pr
699	CHF2	Cl	Et	iPr
700	CHF2	Cl	Pr	Pr
701	CHF2	Cl	H	cpentilo
702	CHF2	Cl	H	chexilo
703	CHF2	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
704	CHF2	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
705	CHF2	Cl	H	CH ₂ -cPr
706	CHF2	Cl	H	CH ₂ -CN
707	CHF2	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
708	CHF2	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
709	CHF2	Cl	H	CH ₂ CF ₃
710	CHF2	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
711	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
712	CHF2	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
713	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
714	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
715	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
716	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
717	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
718	CHF2	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
719	CHF2	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
720	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
721	CHF2	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
722	CHF2	Cl	H	CH ₂ -C≡CH
723	CHF2	Cl	Me	CH ₂ -C≡CH
724	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
725	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
726	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
727	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
728	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
729	CHF2	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
730	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
731	CHF2	Cl	H	CH(CH3)C(CH3)3
732	CHF2	Cl	H	CH(CH3)CH(CH3)2
733	CHF2	Cl	H	CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)2
734	CHF2	Cl	H	CH(CH2CH3)2
735	CHF2	Cl	H	C(CH3)2CH2CH3
736	CHF2	Cl	H	C(CH3)2CH2C(CH3)3
737	CHF2	Cl	H	CH2-CH(OMe)2
738	CHF2	Cl	H	CH2-CH(OEt)2
739	CHF2	Cl	H	CH2CH2-OH
740	CHF2	Cl	H	CH2CH2-OMe
741	CHF2	Cl	Me	CH2CH2-OMe
742	CHF2	Cl	H	CH2CH2-OEt
743	CHF2	Cl	H	CH2CH2-SMe
744	CHF2	Cl	H	CH2CH2-CN
745	CHF2	Cl	H	CH2CH2-NMe2
746	CHF2	Cl	H	CH2CH2-morfolin-4-ilo
747	CHF2	Cl	H	CH(CH3)CH2-OMe
748	CHF2	Cl	H	CH(CH3)CH2-NMe2
749	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OMe
750	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-SMe
751	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OEt
752	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OiPr
753	CHF2	Cl	H	CH2CH2CH2-OBu
754	CHF2	Cl	H	CH2-COOCH3
755	CHF2	Cl	Me	CH2-COOCH3
756	CHF2	Cl	H	CH(CH3)COOMe
757	CHF2	Cl	H	CH(CH3)COOEt
758	CHF2	Cl	H	CH2CH2-COOCH3
759	CHF2	Cl	H	CH(COOCH3)2
760	CHF2	Cl	H	CH(COOEt)CH2-CH(CH3)2
761	CHF2	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH3)2
762	CHF2	Cl	H	O-CH2CH3
763	CHF2	Cl	H	O-CH3
764	CHF2	Cl	H	O-CH2CH=CH2

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
765	CHF2	Cl	H	O-tBu
766	CHF2	Cl	H	O-Pr
767	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ cPr
768	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
769	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
770	CHF2	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
771	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
772	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
773	CHF2	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
774	CHF2	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
775	CHF2	Cl	H	CH ₂ -Ph
776	CHF2	Cl	Me	CH ₂ -Ph
777	CHF2	Cl	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
778	CHF2	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
779	CHF2	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
780	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
781	CHF2	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
782	CHF2	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
783	CHF2	Cl		morfolin-4-ilo
784	CHF2	Cl		piperidin-1-ilo
785	CHF2	Cl		tiazolidin-3-ilo
786	CHF2	Cl		pirrolidin-1-ilo
787	CHF2	Cl		2-metil-pirrolidin-1-ilo
788	CHF2	Cl		=CH-N(CH ₃) ₂
789	CHF2	Cl		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
790	CHF2	Cl		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
791	CHF2	Cl		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
792	CHF2	Cl		=CH-piperidina
793	CHF2	Cl		=CH-morfolina
794	CHF2	Cl		=CH-pirrolidina
795	CHF2	Cl	H	indan-1-ilo
796	CHF2	Cl	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
797	CF ₂ CF ₃	Cl	H	H
798	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Me

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
799	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Et
800	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Pr
801	CF ₂ CF ₃	Cl	H	iPr
802	CF ₂ CF ₃	Cl	H	cPr
803	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Bu
804	CF ₂ CF ₃	Cl	H	cBu
805	CF ₂ CF ₃	Cl	H	tBu
806	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	Me
807	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	Et
808	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	Bu
809	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	Pr
810	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	iPr
811	CF ₂ CF ₃	Cl	Et	Et
812	CF ₂ CF ₃	Cl	Et	Pr
813	CF ₂ CF ₃	Cl	Et	iPr
814	CF ₂ CF ₃	Cl	Pr	Pr
815	CF ₂ CF ₃	Cl	H	cpentilo
816	CF ₂ CF ₃	Cl	H	chexilo
817	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
818	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
819	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -cPr
820	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CN
821	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
822	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
823	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
824	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
825	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
826	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
827	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
828	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
829	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
830	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
831	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
832	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
833	CF ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
834	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
835	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
836	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -C=CH
837	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -C=CH
838	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
839	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
840	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
841	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
842	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
843	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
844	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
845	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
846	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
847	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
848	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
849	CF ₂ CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
850	CF ₂ CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
851	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
852	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
853	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
854	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
855	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
856	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
857	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
858	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -CN
859	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
860	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
861	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
862	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
863	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
864	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
865	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
866	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
867	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
868	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
869	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
870	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
871	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(COOCH ₃) ₂
872	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
873	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
874	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₃
875	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₃
876	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
877	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-tBu
878	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-Pr
879	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ cPr
880	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
881	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CF ₃
882	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)cPr
883	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
884	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CH
885	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
886	CF ₂ CF ₃	Cl	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
887	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -Ph
888	CF ₂ CF ₃	Cl	Me	CH ₂ -Ph
889	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
890	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
891	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃)Ph
892	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
893	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
894	CF ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
895	CF ₂ CF ₃	Cl		morfolin-4-ilo
896	CF ₂ CF ₃	Cl		piperidin-1-ilo
897	CF ₂ CF ₃	Cl		tiazolidin-3-ilo
898	CF ₂ CF ₃	Cl		pirrolidin-1-ilo
899	CF ₂ CF ₃	Cl		2-metilo-pirrolidin-1-ilo
900	CF ₂ CF ₃	Cl		=CH-N(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
901	CF ₂ CF ₃	Cl		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
902	CF ₂ CF ₃	Cl		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
903	CF ₂ CF ₃	Cl		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
904	CF ₂ CF ₃	Cl		=CH-piperidina
905	CF ₂ CF ₃	Cl		=CH-morfolina
906	CF ₂ CF ₃	Cl		=CH-pirrolidina
907	CF ₂ CF ₃	Cl	H	indan-1-ilo
908	CF ₂ CF ₃	Cl	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
909	CF ₃	Br	H	H
910	CF ₃	Br	H	Me
911	CF ₃	Br	H	Et
912	CF ₃	Br	H	Pr
913	CF ₃	Br	H	iPr
914	CF ₃	Br	H	cPr
915	CF ₃	Br	H	Bu
916	CF ₃	Br	H	cBu
917	CF ₃	Br	H	tBu
918	CF ₃	Br	Me	Me
919	CF ₃	Br	Me	Et
920	CF ₃	Br	Me	Bu
921	CF ₃	Br	Me	Pr
922	CF ₃	Br	Me	iPr
923	CF ₃	Br	Et	Et
924	CF ₃	Br	Et	Pr
925	CF ₃	Br	Et	iPr
926	CF ₃	Br	Pr	Pr
927	CF ₃	Br	H	cpentilo
928	CF ₃	Br	H	chexilo
929	CF ₃	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
930	CF ₃	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
931	CF ₃	Br	H	CH ₂ -cPr
932	CF ₃	Br	H	CH ₂ -CN
933	CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
934	CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
935	CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₃
936	CF ₃	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
937	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
938	CF ₃	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
939	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
940	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
941	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
942	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
943	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
944	CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
945	CF ₃	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
946	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
947	CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
948	CF ₃	Br	H	CH ₂ -C≡CH
949	CF ₃	Br	Me	CH ₂ -C≡CH
950	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
951	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)cPr
952	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
953	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
954	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
955	CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
956	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
957	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
958	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
959	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
960	CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
961	CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
962	CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
963	CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
964	CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
965	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
966	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
967	CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
968	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OEt

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
969	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
970	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -CN
971	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
972	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
973	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
974	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
975	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
976	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
977	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
978	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
979	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
980	CF ₃	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
981	CF ₃	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
982	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
983	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
984	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
985	CF ₃	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂
986	CF ₃	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
987	CF ₃	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
988	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
989	CF ₃	Br	Me	O-CH ₃
990	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
991	CF ₃	Br	H	O-tBu
992	CF ₃	Br	H	O-Pr
993	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ cPr
994	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
995	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
996	CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
997	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
998	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
999	CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1000	CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1001	CF ₃	Br	H	CH ₂ -Ph
1002	CF ₃	Br	Me	CH ₂ -Ph

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1003	CF ₃	Br	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1004	CF ₃	Br	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1005	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1006	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1007	CF ₃	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1008	CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1009	CF ₃	Br		morfolin-4-ilo
1010	CF ₃	Br		piperidin-1-ilo
1011	CF ₃	Br		tiazolidin-3-ilo
1012	CF ₃	Br		pirrolidin-1-ilo
1013	CF ₃	Br		2-metil-pirrolidin-1-ilo
1014	CF ₃	Br		=CH-N(CH ₃) ₂
1015	CF ₃	Br		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1016	CF ₃	Br		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1017	CF ₃	Br		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1018	CF ₃	Br		=CH-piperidina
1019	CF ₃	Br		=CH-morfolina
1020	CF ₃	Br		=CH-pirrolidina
1021	CF ₃	Br	H	indan-1-ilo
1022	CF ₃	Br	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
1023	CF ₂ Cl	Br	H	H
1024	CF ₂ Cl	Br	H	Me
1025	CF ₂ Cl	Br	H	Et
1026	CF ₂ Cl	Br	H	Pr
1027	CF ₂ Cl	Br	H	iPr
1028	CF ₂ Cl	Br	H	cPr
1029	CF ₂ Cl	Br	H	Bu
1030	CF ₂ Cl	Br	H	cBu
1031	CF ₂ Cl	Br	H	tBu
1032	CF ₂ Cl	Br	Me	Me
1033	CF ₂ Cl	Br	Me	Et
1034	CF ₂ Cl	Br	Me	Bu
1035	CF ₂ Cl	Br	Me	Pr
1036	CF ₂ Cl	Br	Me	iPr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1037	CF ₂ Cl	Br	Et	Et
1038	CF ₂ Cl	Br	Et	Pr
1039	CF ₂ Cl	Br	Et	iPr
1040	CF ₂ Cl	Br	Pr	Pr
1041	CF ₂ Cl	Br	H	cpentilo
1042	CF ₂ Cl	Br	H	chexilo
1043	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1044	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1045	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -cPr
1046	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CN
1047	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1048	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1049	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CF ₃
1050	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1051	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1052	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1053	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1054	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1055	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1056	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1057	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1058	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1059	CF ₂ Cl	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1060	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1061	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1062	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C≡CH
1063	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -C=CH
1064	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1065	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1066	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1067	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1068	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1069	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1070	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1071	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1072	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1073	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1074	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1075	CF ₂ Cl	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1076	CF ₂ Cl	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1077	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1078	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1079	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1080	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1081	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1082	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1083	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1084	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1085	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1086	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
1087	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1088	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1089	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1090	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1091	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1092	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1093	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1094	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
1095	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1096	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
1097	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
1098	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1099	CF ₂ Cl	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂
1100	CF ₂ Cl	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1101	CF ₂ Cl	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1102	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
1103	CF ₂ Cl	Br	Me	O-CH ₃
1104	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1105	CF ₂ Cl	Br	H	O-tBu
1106	CF ₂ Cl	Br	H	O-Pr
1107	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ cPr
1108	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1109	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
1110	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
1111	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1112	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
1113	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1114	CF ₂ Cl	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1115	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -Ph
1116	CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -Ph
1117	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1118	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1119	CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1120	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1121	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1122	CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1123	CF ₂ Cl	Br		morfolin-4-ilo
1124	CF ₂ Cl	Br		piperidin-1-ilo
1125	CF ₂ Cl	Br		tiazolidin-3-ilo
1126	CF ₂ Cl	Br		pirrolidin-1-ilo
1127	CF ₂ Cl	Br		2-metil-pirrolidin-1-ilo
1128	CF ₂ Cl	Br		=CH-N(CH ₃) ₂
1129	CF ₂ Cl	Br		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1130	CF ₂ Cl	Br		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1131	CF ₂ Cl	Br		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1132	CF ₂ Cl	Br		=CH-piperidina
1133	CF ₂ Cl	Br		=CH-morfolina
1134	CF ₂ Cl	Br		=CH-pirrolidina
1135	CF ₂ Cl	Br	H	indan-1-ilo
1136	CF ₂ Cl	Br	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
1137	CHF ₂	Br	H	H
1138	CHF ₂	Br	H	Me

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1139	CHF2	Br	H	Et
1140	CHF2	Br	H	Pr
1141	CHF2	Br	H	iPr
1142	CHF2	Br	H	cPr
1143	CHF2	Br	H	Bu
1144	CHF2	Br	H	cBu
1145	CHF2	Br	H	tBu
1146	CHF2	Br	Me	Me
1147	CHF2	Br	Me	Et
1148	CHF2	Br	Me	Bu
1149	CHF2	Br	Me	Pr
1150	CHF2	Br	Me	iPr
1151	CHF2	Br	Et	Et
1152	CHF2	Br	Et	Pr
1153	CHF2	Br	Et	iPr
1154	CHF2	Br	Pr	Pr
1155	CHF2	Br	H	cpentilo
1156	CHF2	Br	H	chexilo
1157	CHF2	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1158	CHF2	Br	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1159	CHF2	Br	H	CH ₂ -cPr
1160	CHF2	Br	H	CH ₂ -CN
1161	CHF2	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1162	CHF2	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1163	CHF2	Br	H	CH ₂ CF ₃
1164	CHF2	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1165	CHF2	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1166	CHF2	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1167	CHF2	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1168	CHF2	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1169	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1170	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1171	CHF2	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1172	CHF2	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1173	CHF2	Br	CH2CH=CH2	CH2CH=CH2
1174	CHF2	Br	H	CH2CH=CHCH3
1175	CHF2	Br	H	CH2-C(CH3)=CH2
1176	CHF2	Br	H	CH2-C≡CH
1177	CHF2	Br	Me	CH2-C≡CH
1178	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2CH3
1179	CHF2	Br	H	CH(CH3)cPr
1180	CHF2	Br	H	CH(CH3)(CH2)2CH3
1181	CHF2	Br	H	CH(CH3)(CH2)4CH3
1182	CHF2	Br	H	CH(CH3)(CH2)5CH3
1183	CHF2	Br	H	CH(CH2CH3)(CH2)3CH3
1184	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2CH(CH3)2
1185	CHF2	Br	H	CH(CH3)C(CH3)3
1186	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH(CH3)2
1187	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)2
1188	CHF2	Br	H	CH(CH2CH3)2
1189	CHF2	Br	H	C(CH3)2CH2CH3
1190	CHF2	Br	H	C(CH3)2CH2C(CH3)3
1191	CHF2	Br	H	CH2-CH(OMe)2
1192	CHF2	Br	H	CH2-CH(OEt)2
1193	CHF2	Br	H	CH2CH2-OH
1194	CHF2	Br	H	CH2CH2-OMe
1195	CHF2	Br	Me	CH2CH2-OMe
1196	CHF2	Br	H	CH2CH2-OEt
1197	CHF2	Br	H	CH2CH2-SMe
1198	CHF2	Br	H	CH2CH2-CN
1199	CHF2	Br	H	CH2CH2-NMe2
1200	CHF2	Br	H	CH2CH2-morfolin-4-ilo
1201	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2-OMe
1202	CHF2	Br	H	CH(CH3)CH2-NMe2
1203	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OMe
1204	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-SMe
1205	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OEt
1206	CHF2	Br	H	CH2CH2CH2-OiPr

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1207	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1208	CHF2	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
1209	CHF2	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1210	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
1211	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
1212	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1213	CHF2	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂
1214	CHF2	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1215	CHF2	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1216	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
1217	CHF2	Br	Me	O-CH ₃
1218	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1219	CHF2	Br	H	O-tBu
1220	CHF2	Br	H	O-Pr
1221	CHF2	Br	H	O-CH ₂ cPr
1222	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1223	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
1224	CHF2	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
1225	CHF2	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1226	CHF2	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
1227	CHF2	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1228	CHF2	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1229	CHF2	Br	H	CH ₂ -Ph
1230	CHF2	Br	Me	CH ₂ -Ph
1231	CHF2	Br	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1232	CHF2	Br	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1233	CHF2	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1234	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1235	CHF2	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1236	CHF2	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1237	CHF2	Br		morfolin-4-ilo
1238	CHF2	Br		piperidin-1-ilo
1239	CHF2	Br		tiazolidin-3-ilo
1240	CHF2	Br		pirrolidin-1-ilo

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1241	CHF2	Br		2-metil-pirrolidin-1-ilo
1242	CHF2	Br		=CH-N(CH3)2
1243	CHF2	Br		=C(CH3)N(CH3)2
1244	CHF2	Br		=CH-N(C2H5)2
1245	CHF2	Br		=C(CH3)N(C2H5)2
1246	CHF2	Br		=CH-piperidina
1247	CHF2	Br		=CH-morfolina
1248	CHF2	Br		=CH-pirrolidina
1249	CHF2	Br	H	indan-1-ilo
1250	CHF2	Br	H	tetrahidrofuran-2-ilmetil
1251	CF2CF3	Br	H	H
1252	CF2CF3	Br	H	Me
1253	CF2CF3	Br	H	Et
1254	CF2CF3	Br	H	Pr
1255	CF2CF3	Br	H	iPr
1256	CF2CF3	Br	H	cPr
1257	CF2CF3	Br	H	Bu
1258	CF2CF3	Br	H	cBu
1259	CF2CF3	Br	H	tBu
1260	CF2CF3	Br	Me	Me
1261	CF2CF3	Br	Me	Et
1262	CF2CF3	Br	Me	Bu
1263	CF2CF3	Br	Me	Pr
1264	CF2CF3	Br	Me	iPr
1265	CF2CF3	Br	Et	Et
1266	CF2CF3	Br	Et	Pr
1267	CF2CF3	Br	Et	iPr
1268	CF2CF3	Br	Pr	Pr
1269	CF2CF3	Br	H	cpentilo
1270	CF2CF3	Br	H	chexilo
1271	CF2CF3	Br	H	CH2(CH2)3CH3
1272	CF2CF3	Br	H	CH2(CH2)4CH3
1273	CF2CF3	Br	H	CH2-cPr
1274	CF2CF3	Br	H	CH2-CN

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1275	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1276	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1277	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CF ₃
1278	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1279	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1280	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1281	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1282	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1283	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1284	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1285	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1286	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1287	CF ₂ CF ₃	Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1288	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1289	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1290	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -C≡CH
1291	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ -C≡CH
1292	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1293	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1294	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1295	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1296	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1297	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1298	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1299	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1300	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1301	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1302	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1303	CF ₂ CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1304	CF ₂ CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1305	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1306	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1307	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1308	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1309	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1310	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1311	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1312	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1313	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1314	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
1315	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1316	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1317	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1318	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1319	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1320	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1321	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1322	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
1323	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1324	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
1325	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
1326	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1327	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(COOCH ₃) ₂
1328	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1329	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1330	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₃
1331	CF ₂ CF ₃	Br	Me	O-CH ₃
1332	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1333	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-tBu
1334	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-Pr
1335	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ cPr
1336	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1337	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CF ₃
1338	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)cPr
1339	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1340	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CH
1341	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1342	CF ₂ CF ₃	Br	H	O-CH(CH ₃)C≡CH

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1343	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -Ph
1344	CF ₂ CF ₃	Br	Me	CH ₂ -Ph
1345	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1346	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1347	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH(CH ₃)Ph
1348	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1349	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1350	CF ₂ CF ₃	Br	H	CH ₂ CH ₂ CHPh ₂
1351	CF ₂ CF ₃	Br		morfolin-4-ilo
1352	CF ₂ CF ₃	Br		piperidin-1-ilo
1353	CF ₂ CF ₃	Br		tiazolidin-3-ilo
1354	CF ₂ CF ₃	Br		pirrolidin-1-ilo
1355	CF ₂ CF ₃	Br		2-metil-pirrolidin-1-ilo
1356	CF ₂ CF ₃	Br		=CH-N(CH ₃) ₂
1357	CF ₂ CF ₃	Br		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1358	CF ₂ CF ₃	Br		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1359	CF ₂ CF ₃	Br		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1360	CF ₂ CF ₃	Br		=CH-piperidina
1361	CF ₂ CF ₃	Br		=CH-morfolina
1362	CF ₂ CF ₃	Br		=CH-pirrolidina
1363	CF ₂ CF ₃	Br	H	indan-1-ilo
1364	CF ₂ CF ₃	Br	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
1365	CF ₂ CF ₃	I	H	H
1366	CF ₃	I	H	H
1367	CF ₂ CHF ₂	H	H	H
1368	CF ₂ CHF ₂	H	H	Me
1369	CF ₂ CHF ₂	H	H	Et
1370	CF ₂ CHF ₂	H	H	Pr
1371	CF ₂ CHF ₂	H	H	iPr
1372	CF ₂ CHF ₂	H	H	cPr
1373	CF ₂ CHF ₂	H	H	Bu
1374	CF ₂ CHF ₂	H	H	cBu
1375	CF ₂ CHF ₂	H	H	tBu
1376	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Me

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1377	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Et
1378	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Bu
1379	CF ₂ CHF ₂	H	Me	Pr
1380	CF ₂ CHF ₂	H	Me	iPr
1381	CF ₂ CHF ₂	H	Et	Et
1382	CF ₂ CHF ₂	H	Et	Pr
1383	CF ₂ CHF ₂	H	Et	iPr
1384	CF ₂ CHF ₂	H	Pr	Pr
1385	CF ₂ CHF ₂	H	H	cpentilo
1386	CF ₂ CHF ₂	H	H	chexilo
1387	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1388	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1389	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -cPr
1390	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -CN
1391	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1392	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1393	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CF ₃
1394	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1395	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1396	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1397	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1398	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1399	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1400	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1401	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
1402	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1403	CF ₂ CHF ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1404	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1405	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1406	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -C≡CH
1407	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ -C≡CH
1408	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1409	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)cPr
1410	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1411	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1412	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1413	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1414	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1415	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1416	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1417	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1418	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1419	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1420	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1421	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1422	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1423	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1424	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1425	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1426	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1427	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1428	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1429	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1430	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
1431	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1432	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1433	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1434	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1435	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1436	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1437	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1438	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
1439	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1440	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)COOMe
1441	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)COOEt
1442	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1443	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
1444	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

1445	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1446	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH ₃
1447	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₃
1448	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1449	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-tBu
1450	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-Pr
1451	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ cPr
1452	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1453	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CF ₃
1454	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
1455	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1456	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ C≡CH
1457	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1458	CF ₂ CHF ₂	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1459	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -Ph
1460	CF ₂ CHF ₂	H	Me	CH ₂ -Ph
1461	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1462	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1463	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH(CH ₃)Ph
1464	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1465	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1466	CF ₂ CHF ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
1467	CF ₂ CHF ₂	H		morfolin-4-ilo
1468	CF ₂ CHF ₂	H		piperidin-1-ilo
1469	CF ₂ CHF ₂	H		tiazolidin-3-ilo
1470	CF ₂ CHF ₂	H		pirrolidin-1-ilo
1471	CF ₂ CHF ₂	H		2-metilo-pirrolidin-1-ilo
1472	CF ₂ CHF ₂	H		=CH-N(CH ₃) ₂
1473	CF ₂ CHF ₂	H		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1474	CF ₂ CHF ₂	H		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1475	CF ₂ CHF ₂	H		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1476	CF ₂ CHF ₂	H		=CH-piperidin
1477	CF ₂ CHF ₂	H		=CH-morfolina
1478	CF ₂ CHF ₂	H		=CH-pirrolidina
1479	CF ₂ CHF ₂	H	H	indan-1-ilo

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1480	CF ₂ CHF ₂	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
1481	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	H
1482	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	Me
1483	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	Et
1484	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	Pr
1485	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	iPr
1486	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cPr
1487	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	Bu
1488	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cBu
1489	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	tBu
1490	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Me
1491	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Et
1492	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Bu
1493	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	Pr
1494	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	iPr
1495	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Et	Et
1496	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Et	Pr
1497	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Et	iPr
1498	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Pr	Pr
1499	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	cpentilo
1500	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	chexilo
1501	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1502	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1503	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -cPr
1504	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CN
1505	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1506	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1507	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
1508	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1509	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1510	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1511	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1512	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1513	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1514	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1515	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
1516	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1517	CF ₂ CF ₂ Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1518	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1519	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1520	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -C≡CH
1521	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -C=CH
1522	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1523	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)cPr
1524	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1525	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1526	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1527	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1528	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1529	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1530	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1531	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1532	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1533	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1534	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1535	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1536	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1537	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1538	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1539	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1540	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1541	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1542	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1543	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1544	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
1545	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1546	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1547	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1548	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1549	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1550	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1551	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1552	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
1553	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1554	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOMe
1555	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)COOEt
1556	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1557	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
1558	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1559	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1560	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₃
1561	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₃
1562	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1563	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-tBu
1564	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-Pr
1565	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ cPr
1566	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1567	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CF ₃
1568	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
1569	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl
1570	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CH
1571	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1572	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1573	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -Ph
1574	CF ₂ CF ₂ Cl	H	Me	CH ₂ -Ph
1575	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1576	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1577	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH(CH ₃)Ph
1578	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1579	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1580	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
1581	CF ₂ CF ₂ Cl	H		morfolin-4-ilo

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1582	CF ₂ CF ₂ Cl	H		piperidin-1-ilo
1583	CF ₂ CF ₂ Cl	H		tiazolidin-3-ilo
1584	CF ₂ CF ₂ Cl	H		pirrolidin-1-ilo
1585	CF ₂ CF ₂ Cl	H		2-metil-pirrolidin-1-ilo
1586	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=CH-N(CH ₃) ₂
1587	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1588	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1589	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1590	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=CH-piperidina
1591	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=CH-morfolina
1592	CF ₂ CF ₂ Cl	H		=CH-pirrolidina
1593	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	indan-1-ilo
1594	CF ₂ CF ₂ Cl	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
1595	C ₃ F ₇	H	H	H
1596	C ₃ F ₇	H	H	Me
1597	C ₃ F ₇	H	H	Et
1598	C ₃ F ₇	H	H	Pr
1599	C ₃ F ₇	H	H	iPr
1600	C ₃ F ₇	H	H	cPr
1601	C ₃ F ₇	H	H	Bu
1602	C ₃ F ₇	H	H	cBu
1603	C ₃ F ₇	H	H	tBu
1604	C ₃ F ₇	H	Me	Me
1605	C ₃ F ₇	H	Me	Et
1606	C ₃ F ₇	H	Me	Bu
1607	C ₃ F ₇	H	Me	Pr
1608	C ₃ F ₇	H	Me	iPr
1609	C ₃ F ₇	H	Et	Et
1610	C ₃ F ₇	H	Et	Pr
1611	C ₃ F ₇	H	Et	iPr
1612	C ₃ F ₇	H	Pr	Pr
1613	C ₃ F ₇	H	H	cpentilo
1614	C ₃ F ₇	H	H	chexilo
1615	C ₃ F ₇	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1616	C3F7	H	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1617	C3F7	H	H	CH ₂ -cPr
1618	C3F7	H	H	CH ₂ -CN
1619	C3F7	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1620	C3F7	H	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃
1621	C3F7	H	H	CH ₂ CF ₃
1622	C3F7	H	H	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
1623	C3F7	H	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1624	C3F7	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F
1625	C3F7	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1626	C3F7	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1627	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1628	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1629	C3F7	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
1630	C3F7	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1631	C3F7	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
1632	C3F7	H	H	CH ₂ CH=CHCH ₃
1633	C3F7	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1634	C3F7	H	H	CH ₂ -C=CH
1635	C3F7	H	Me	CH ₂ -C=CH
1636	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1637	C3F7	H	H	CH(CH ₃)cPr
1638	C3F7	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1639	C3F7	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1640	C3F7	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1641	C3F7	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1642	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1643	C3F7	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1644	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1645	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1646	C3F7	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1647	C3F7	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1648	C3F7	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1649	C3F7	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1650	C3F7	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1651	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1652	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1653	C3F7	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1654	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1655	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -SMe
1656	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -CN
1657	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -NMe ₂
1658	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -morfolin-4-ilo
1659	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1660	C3F7	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -NMe ₂
1661	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1662	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -SMe
1663	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OEt
1664	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OiPr
1665	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OBu
1666	C3F7	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
1667	C3F7	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1668	C3F7	H	H	CH(CH ₃)COOMe
1669	C3F7	H	H	CH(CH ₃)COOEt
1670	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1671	C3F7	H	H	CH(COOCH ₃) ₂
1672	C3F7	H	H	CH(COOEt)CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
1673	C3F7	H	H	CH(COOMe)CH(CH ₃) ₂
1674	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH ₃
1675	C3F7	H	H	O-CH ₃
1676	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH=CH ₂
1677	C3F7	H	H	O-tBu
1678	C3F7	H	H	O-Pr
1679	C3F7	H	H	O-CH ₂ cPr
1680	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1681	C3F7	H	H	O-CH ₂ CF ₃
1682	C3F7	H	H	O-CH(CH ₃)cPr
1683	C3F7	H	H	O-CH ₂ CH ₂ Cl

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1684	C3F7	H	H	O-CH ₂ C≡CH
1685	C3F7	H	H	O-CH ₂ C≡CCH ₃
1686	C3F7	H	H	O-CH(CH ₃)C≡CH
1687	C3F7	H	H	CH ₂ -Ph
1688	C3F7	H	Me	CH ₂ -Ph
1689	C3F7	H	H	CH ₂ -piridin-3-ilo
1690	C3F7	H	H	CH ₂ -6-Cl-piridin-3-ilo
1691	C3F7	H	H	CH(CH ₃)Ph
1692	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ -Ph
1693	C3F7	H	H	CH ₂ -2-CF ₃ -Ph
1694	C3F7	H	H	CH ₂ CH ₂ CHPh
1695	C3F7	H		morfolin-4-ilo
1696	C3F7	H		piperidin-1-ilo
1697	C3F7	H		tiazolidin-3-ilo
1698	C3F7	H		pirrolidin-1-ilo
1699	C3F7	H		2-metil-pirrolidin-1-ilo
1700	C3F7	H		=CH-N(CH ₃) ₂
1701	C3F7	H		=C(CH ₃)N(CH ₃) ₂
1702	C3F7	H		=CH-N(C ₂ H ₅) ₂
1703	C3F7	H		=C(CH ₃)N(C ₂ H ₅) ₂
1704	C3F7	H		=CH-piperidina
1705	C3F7	H		=CH-morfolina
1706	C3F7	H		=CH-pirrolidina
1707	C3F7	H	H	indan-1-ilo
1708	C3F7	H	H	tetrahidrofuran-2-ilmetilo
1709	CF(CF ₃) ₂	H	H	H
1710	C3F7	Cl	H	H
1711	C3F7	Cl	H	Me
1712	C3F7	Cl	H	Et
1713	C3F7	Cl	H	Pr
1714	C3F7	Cl	H	iPr
1715	C3F7	Cl	H	cPr
1716	C3F7	Cl	H	Bu
1717	C3F7	Cl	H	cBu

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1718	C3F7	Cl	H	tBu
1719	C3F7	Cl	Me	Me
1720	C3F7	Cl	Et	Et
1721	C3F7	Cl	H	CH ₂ -cPr
1722	C3F7	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1723	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1724	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1725	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1726	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1727	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
1728	C3F7	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1729	C3F7	Cl	H	CH ₂ -CCH
1730	C3F7	Cl	Me	CH ₂ -CCH
1731	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1732	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
1733	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1734	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1735	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1736	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1737	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1738	C3F7	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1739	C3F7	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1740	C3F7	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1741	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1742	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1743	C3F7	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1744	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1745	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1746	C3F7	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
1747	C3F7	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1748	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
1749	C3F7	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
1750	C3F7	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1751	C3F7	Br	H	H

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R1	R2	R3	R4
1752	C3F7	Br	H	Me
1753	C3F7	Br	H	Et
1754	C3F7	Br	H	Pr
1755	C3F7	Br	H	iPr
1756	C3F7	Br	H	cPr
1757	C3F7	Br	H	Bu
1758	C3F7	Br	H	cBu
1759	C3F7	Br	H	tBu
1760	C3F7	Br	Me	Me
1761	C3F7	Br	Et	Et
1762	C3F7	Br	H	CH ₂ -cPr
1763	C3F7	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1764	C3F7	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1765	C3F7	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1766	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1767	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1768	C3F7	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
1769	C3F7	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1770	C3F7	Br	H	CH ₂ -CCH
1771	C3F7	Br	Me	CH ₂ -CCH
1772	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1773	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)cPr
1774	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1775	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1776	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1777	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1778	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1779	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1780	C3F7	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1781	C3F7	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1782	C3F7	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1783	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1784	C3F7	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1785	C3F7	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1786	C3F7	Br	H	CH2CH2CH2-OMe
1787	C3F7	Br	H	CH2-COOCH3
1788	C3F7	Br	Me	CH2-COOCH3
1789	C3F7	Br	H	CH(CH3)COOMe
1790	C3F7	Br	H	CH(CH3)COOEt
1791	C3F7	Br	H	CH2CH2-COOCH3
1792	C3F7	I	H	H
1793	C3F7	I	H	Me
1794	C3F7	I	H	Et
1795	C3F7	I	H	Pr
1796	C3F7	I	H	iPr
1797	C3F7	I	H	cPr
1798	C3F7	I	H	Bu
1799	C3F7	I	H	cBu
1800	C3F7	I	H	tBu
1801	C3F7	I	Me	Me
1802	C3F7	I	Et	Et
1803	C3F7	I	H	CH2-cPr
1804	C3F7	I	H	CH2-C(CH3)3
1805	C3F7	I	H	CH2CH(CH3)2
1806	C3F7	I	H	CH2CH(CH2CH3)2
1807	C3F7	I	H	CH2CH2CH(CH3)2
1808	C3F7	I	H	CH2CH2C(CH3)3
1809	C3F7	I	H	CH2CH=CH2
1810	C3F7	I	H	CH2-C(CH3)=CH2
1811	C3F7	I	H	CH2-CCH
1812	C3F7	I	Me	CH2-CCH
1813	C3F7	I	H	CH(CH3)CH2CH3
1814	C3F7	I	H	CH(CH3)cPr
1815	C3F7	I	H	CH(CH3)(CH2)2CH3
1816	C3F7	I	H	CH(CH3)(CH2)4CH3
1817	C3F7	I	H	CH(CH3)CH2CH(CH3)2
1818	C3F7	I	H	CH(CH3)C(CH3)3
1819	C3F7	I	H	CH(CH3)CH(CH3)2

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1820	C3F7	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1821	C3F7	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1822	C3F7	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1823	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1824	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1825	C3F7	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1826	C3F7	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1827	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1828	C3F7	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1829	C3F7	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1830	C3F7	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1831	C3F7	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1832	C3F7	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1833	CF ₃	I	H	Me
1834	CF ₃	I	H	Et
1835	CF ₃	I	H	Pr
1836	CF ₃	I	H	iPr
1837	CF ₃	I	H	cPr
1838	CF ₃	I	H	Bu
1839	CF ₃	I	H	cBu
1840	CF ₃	I	H	tBu
1841	CF ₃	I	Me	Me
1842	CF ₃	I	Et	Et
1843	CF ₃	I	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃
1844	CF ₃	I	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃
1845	CF ₃	I	H	CH ₂ -cPr
1846	CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1847	CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1848	CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1849	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1850	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1851	CF ₃	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
1852	CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1853	CF ₃	I	H	CH ₂ -CCH

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1854	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1855	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)cPr
1856	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1857	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1858	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1859	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1860	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1861	CF ₃	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1862	CF ₃	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1863	CF ₃	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1864	CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1865	CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1866	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1867	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1868	CF ₃	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1869	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1870	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1871	CF ₃	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1872	CF ₃	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1873	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1874	CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1875	CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1876	CF ₂ Cl	I	H	H
1877	CF ₂ Cl	I	H	Me
1878	CF ₂ Cl	I	H	Et
1879	CF ₂ Cl	I	H	Pr
1880	CF ₂ Cl	I	H	iPr
1881	CF ₂ Cl	I	H	cPr
1882	CF ₂ Cl	I	H	Bu
1883	CF ₂ Cl	I	H	cBu
1884	CF ₂ Cl	I	H	tBu
1885	CF ₂ Cl	I	Me	Me
1886	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -cPr
1887	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1888	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1889	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1890	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1891	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1892	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
1893	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1894	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1895	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CCH
1896	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -CCH
1897	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1898	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)cPr
1899	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1900	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1901	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃
1902	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃
1903	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1904	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1905	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1906	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1907	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1908	CF ₂ Cl	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
1909	CF ₂ Cl	I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1910	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1911	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1912	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1913	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1914	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1915	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OEt
1916	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1917	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1918	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1919	CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1920	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1921	CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOEt

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1922	CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1923	CF ₂ CF ₃	I	H	Me
1924	CF ₂ CF ₃	I	H	Et
1925	CF ₂ CF ₃	I	H	Pr
1926	CF ₂ CF ₃	I	H	iPr
1927	CF ₂ CF ₃	I	H	cPr
1928	CF ₂ CF ₃	I	H	Bu
1929	CF ₂ CF ₃	I	H	cBu
1930	CF ₂ CF ₃	I	H	tBu
1931	CF ₂ CF ₃	I	Me	Me
1932	CF ₂ CF ₃	I	Et	Et
1933	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -cPr
1934	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1935	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1936	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1937	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1938	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1939	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
1940	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1941	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1942	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -CCH
1943	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ -CCH
1944	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1945	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)cPr
1946	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1947	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
1948	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1949	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1950	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1951	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1952	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1953	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1954	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1955	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1956	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1957	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
1958	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
1959	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
1960	CF ₂ CF ₃	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
1961	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOMe
1962	CF ₂ CF ₃	I	H	CH(CH ₃)COOEt
1963	CF ₂ CF ₃	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
1964	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	H
1965	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Me
1966	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Et
1967	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Pr
1968	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	iPr
1969	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	cPr
1970	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	Bu
1971	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	cBu
1972	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	tBu
1973	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	Me
1974	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Et	Et
1975	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -cPr
1976	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
1977	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1978	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1979	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1980	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
1981	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
1982	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂
1983	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
1984	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CCH
1985	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -CCH
1986	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
1987	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)cPr
1988	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
1989	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1990	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1991	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
1992	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
1993	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
1994	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
1995	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
1996	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OH
1997	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
1998	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
1999	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2000	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2001	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ -COOCH ₃
2002	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2003	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOMe
2004	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH(CH ₃)COOEt
2005	CF ₂ CF ₂ Cl	Cl	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2006	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	H
2007	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Me
2008	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Et
2009	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Pr
2010	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	iPr
2011	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	cPr
2012	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	Bu
2013	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	cBu
2014	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	tBu
2015	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	Me
2016	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Et	Et
2017	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -cPr
2018	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2019	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2020	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2021	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2022	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2023	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2024	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2025	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2026	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CCH
2027	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -CCH
2028	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2029	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)cPr
2030	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2031	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2032	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2033	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2034	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2035	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2036	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2037	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2038	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2039	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2040	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2041	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2042	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2043	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
2044	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2045	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
2046	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
2047	CF ₂ CF ₂ Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2048	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	H
2049	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Me
2050	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Et
2051	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Pr
2052	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	iPr
2053	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	cPr
2054	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	Bu
2055	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	cBu
2056	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	tBu
2057	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	Me

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2058	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Et	Et
2059	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -cPr
2060	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2061	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2062	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2063	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2064	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2065	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH=CH ₂
2066	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2067	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2068	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CCH
2069	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -CCH
2070	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2071	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)cPr
2072	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2073	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2074	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2075	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2076	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2077	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2078	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2079	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2080	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2081	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2082	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2083	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2084	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2085	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ -COOCH ₃
2086	CF ₂ CF ₂ Cl	I	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2087	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOMe
2088	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH(CH ₃)COOEt
2089	CF ₂ CF ₂ Cl	I	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2090	CFCICF ₃	H	H	H
2091	CFCICF ₃	H	H	Me

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2092	CFCICF3	H	H	Et
2093	CFCICF3	H	H	Pr
2094	CFCICF3	H	H	iPr
2095	CFCICF3	H	H	cPr
2096	CFCICF3	H	H	Bu
2097	CFCICF3	H	H	cBu
2098	CFCICF3	H	H	tBu
2099	CFCICF3	H	Me	Me
2100	CFCICF3	H	Et	Et
2101	CFCICF3	H	H	CH ₂ -cPr
2102	CFCICF3	H	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2103	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2104	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2105	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2106	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2107	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
2108	CFCICF3	H	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2109	CFCICF3	H	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2110	CFCICF3	H	H	CH ₂ -CCH
2111	CFCICF3	H	Me	CH ₂ -CCH
2112	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2113	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)cPr
2114	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2115	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2116	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2117	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃
2118	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2119	CFCICF3	H	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2120	CFCICF3	H	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2121	CFCICF3	H	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2122	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2123	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2124	CFCICF3	H	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2125	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2126	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2127	CFCICF3	H	H	CH ₂ -COOCH ₃
2128	CFCICF3	H	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2129	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)COOMe
2130	CFCICF3	H	H	CH(CH ₃)COOEt
2131	CFCICF3	H	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃
2132	CFCICF3	Br	H	H
2133	CFCICF3	Br	H	Me
2134	CFCICF3	Br	H	Et
2135	CFCICF3	Br	H	Pr
2136	CFCICF3	Br	H	iPr
2137	CFCICF3	Br	H	cPr
2138	CFCICF3	Br	H	Bu
2139	CFCICF3	Br	H	cBu
2140	CFCICF3	Br	H	tBu
2141	CFCICF3	Br	Me	Me
2142	CFCICF3	Br	Et	Et
2143	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -cPr
2144	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
2145	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2146	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2147	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2148	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
2149	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂
2150	CFCICF3	Br	Me	CH ₂ CH=CH ₂
2151	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂
2152	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -C=CH
2153	CFCICF3	Br	Me	CH ₂ -C=CH
2154	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
2155	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)cPr
2156	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
2157	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CH ₃
2158	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
2159	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃

(continuación)

Ej.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
2160	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
2161	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
2162	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -CH(OMe) ₂
2163	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -CH(OEt) ₂
2164	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OH
2165	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ -OMe
2166	CFCICF3	Br	Me	CH ₂ CH ₂ -OMe
2167	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)CH ₂ -OMe
2168	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -OMe
2169	CFCICF3	Br	H	CH ₂ -COOCH ₃
2170	CFCICF3	Br	Me	CH ₂ -COOCH ₃
2171	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)COOMe
2172	CFCICF3	Br	H	CH(CH ₃)COOEt
2173	CFCICF3	Br	H	CH ₂ CH ₂ -COOCH ₃

Tabla 2: Datos de RMN para los compuestos de la Tabla 1

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1	[CDCl ₃] 3,03 (d, 3H); 6,88 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,22 (a, 1H)
2	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 3,5 (m, 2H); 6,92 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,33 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
3	[CDCl ₃] 1,02 (t, 3H); 1,62 (m, 2H); 3,42 (m, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
4	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,22 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,22 (d, a, 1H)
5	[CDCl ₃] 0,61 (m, 2H); 0,89 (m, 2H); 3,00 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,31 (a, 1H)
6	[CDCl ₃] 0,96 (t, 3H); 1,41 (m, 2H); 1,61 (m, 2H); 3,48 (c, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,31 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
7	[CDCl ₃] 1,80 (m, 2H); 2,00 (m, 2H); 2,42 (m, 2H); 4,55 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,50 (a, 1H)
8	[CDCl ₃] 1,44 (s, 9H); 6,90 (d, 1H); 8,62 (d, 1H); 9,32 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
9	[CDCl ₃] 3,05 (s, 6H); 7,10 (d, 1H); 7,77 (d, 1H)
10	[CDCl ₃] 1,22 (t, 3H); 3,02 (s, 3H); 3,46 (m, 2H); 7,08 (d, 1H); 7,77 (d, 1H)
11	[CDCl ₃] 0,90 (t, 3H); 1,30 (a, 2H); 1,60 (m, 2H); 3,03 (s, 3H); 3,42 (a, 2H); 7,10 (d, 1H); 7,74 (d, 1H)
13	[CDCl ₃] 1,20 (d, 6H); 2,90 (s, 3H); 4,05 (m, a, 1H); 7,03 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 11,2 (a)
14	[CDCl ₃] 1,20 (t, 6H); 3,40 (m, 4H); 7,05 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 11,1 (a)
16	[CDCl ₃] 1,21 (m, 9H); 3,39 (c, 2H); 4,0 (a, 1H); 7,04 (d, 1H); 7,68 (d, 1H); 10,6 (a, 1H)
18	[CDCl ₃] 1,5-1,8 (m, 8H); 4,40 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,40 (d, a, 1H); 13,5 (a)
19	[CDCl ₃] 1,2-1,5 (m, 6H); 1,76 (m, 2H); 2,00 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
20	[CDCl ₃] 0,90 (t, 3H); 1,38 (m, 4H); 1,61 (m, 2H); 3,41 (m, 2H); 6,86 (d, 1H); 8,63 (d, 1H); 9,20 (t, 1H)
22	[CDCl ₃] 0,30 (m, 2H); 0,60 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,30 (m, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,38 (a, 1H)
24	[CDCl ₃] 1,00 (s, 9H); 3,28 (d, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,73 (d, 1H); 9,4 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
25	[CDCl ₃] 4,18 (dt, 2H); 6,92 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,8 (t, a, 1H)
26	[CDCl ₃] 4,11 (m, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,80 (a, 1H); 12,16 (a, 1H)
27	[CDCl ₃] 4,22 (dt, 2H); 6,93 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,80 (t, a, 1H)
30	[CDCl ₃] 1,00 (d, 6H); 1,87 (m, 1H); 3,29 (t, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,32 (a, 1H); 12,5 (a, 1H)
32	[CDCl ₃] 0,95 (d, 6H); 1,48 (m, 2H); 1,70 (m, 1H); 3,48 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,22 (a, 1H); 12,6 (a)
34	[CDCl ₃] 4,10 (t, 2H); 5,22 (dd, 2H); 5,95 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,40 (a, 1H); 12,7 (a, 1H)
36	[CDCl ₃] 4,0 (m, 4H); 5,21 (d, 4H); 5,80 (m, 2H); 7,04 (d, 1H); 7,78 (d, 1H); 11,0 (a)
38	[CDCl ₃] 1,80 (s, 3H); 4,02 (d, 2H); 4,93 (d, 2H); 6,89 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,43 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
39	[CDCl ₃] 2,24 (t, 1H); 4,22 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,50 (a, 1H)
40	[CDCl ₃] 2,30 (s, 1H); 3,12 (s, 3H); 4,22 (a, 2H); 7,04 (d, 1H); 7,84 (d, 1H); 10,9 (a)
41	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,58 (m, 2H); 4,10 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,66 (d, 1H); 9,20 (a, 1H); 13,0 (a, 1H)
43	[DMSO] 0,93 (t, 3H); 1,16 (d, 3H); 1,30 (m, 2H); 1,48 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 7,35 (a, 1H); 7,39 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 13,40 (a)
44	[DMSO] 0,87 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,27 (m, 6H); 1,48 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 7,33 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,80 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
47	[CDCl ₃] 0,93 (d, 6H); 1,22 (d, 3H); 1,35 (m, 1H); 1,50 (m, 1H); 1,65 (m, 1H); 4,23 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,20 (d, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
48	[CDCl ₃] 0,96 (s, 9H); 1,18 (d, 3H); 4,10 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,74 (d, 1H); 9,37 (d, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
49	[CDCl ₃] 0,95 (dt, 6H); 1,20 (d, 3H); 1,80 (m, 1H); 4,07 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,6 (a)
51	[DMSO] 0,85 (t, 6H); 1,45 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,80 (m, 1H); 7,33 (d, a, 1H); 8,38 (d, 1H); 8,65 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
54	[CDCl ₃] 3,40 (s, 6H); 3,62 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,30 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
55	[CDCl ₃] 1,21 (t, 6H); 3,60 (m, 4H); 3,72 (m, 2H); 4,61 (t, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,61 (d, 1H); 9,28 (a, 1H); 12,0 (a)
56	[DMSO] 3,40 (m, 2H); 3,53 (m, 2H); 7,32 (d, a, 1H); 8,45 (d, 1H); 9,05 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
57	[CDCl ₃] 3,40 (s, 3H); 3,56 (t, 2H); 3,64 (m, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,35 (a, 1H)
64	[CDCl ₃] 1,25 (d, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,43 (d, 2H); 4,37 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,0 (a, 1H)
66	[CDCl ₃] 1,90 (m, 2H); 3,34 (s, 3H); 3,46 (t, 2H); 3,55 (c, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,60 (d, 1H); 9,23 (a, 1H); 12,5 (a)
71	[CDCl ₃] 3,80 (s, 3H); 4,22 (d, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,62 (t, 1H),
72	[CDCl ₃] 3,10 (s, 3H); 3,75 (s, 3H); 4,25 (s, 2H); 7,18 (d, 1H); 7,80 (d, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
75	[CDCl ₃] 2,64 (t, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,73 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,61 (d, 1H); 9,41 (t, a, 1H); 12,2 (a, 1H)
76	[CDCl ₃] 3,83 (s, 6H); 5,42 (d, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,63 (d, 1H), 10,2 (a, 1H),
78	[CDCl ₃] 1,05 (t, 6H); 2,30 (m, 1H); 3,78 (s, 3H); 4,72 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,76 (d, a, 1H), 13,6 (a, 1H)
79	[CDCl ₃] 1,35 (t, 3H); 4,10 (c, 2H); 6,91 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 11,46 (s, 1H)
80	(CDCl ₃) 3,41 (s, 3H); 3,68 (s, 3H); 7,18 (d, 1H); 8,32 (d, 1H)
81	[CDCl ₃] 4,50 (d, 2H); 5,3 (m, 2H); 6,0 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 11,43 (s, 1H)
82	[CDCl ₃] 1,36 (s, 9H); 6,92 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 11,22 (s, 1H); 13,0 (a, 1H)
92	[CDCl ₃] 4,62 (d, 2H), 6,84 (d, 1H); 7,3 (m, 5H); 8,70 (d, 1H); 9,65 (a, 1H), 13,0 (a, 1H)
93	[CDCl ₃] 2,95 (s, 3H); 4,65 (a, 2H); 7,05 (d, 1H); 7,3 (m, 5H), 7,82 (d, 1H); 11,7 (a)
94	[DMSO] 4,55 (d, 2H); 7,33 (d, 1H); 7,37 (dd, 1H); 7,75 (dt, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,48 (dd, 1H); 8,58 (s, 1H); 9,45 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
95	[DMSO] 4,55 (d, 2H); 7,30 (d, a, 1H); 7,50 (d, 1H); 7,80 (dd, 1H); 8,37 (m, 2H); 9,55 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
96	[CDCl ₃] 1,59 (d, 3H); 5,25 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 7,2-7,4 (m, 5H); 8,68 (d, 1H); 9,75 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
97	[CDCl ₃] 2,94 (t, 2H); 3,70 (m, 2H); 6,85 (d, 1H); 7,2-7,4 (m, 5H); 8,62 (d, 1H); 9,24 (a, 1H)
98	[CDCl ₃] 4,81 (d, 2H); 6,85 (d, 1H); 7,40 (t, 1H); 7,52 (t, 1H); 7,61 (d, 1H); 7,67 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,68 (t, a, 1H)
99	[DMSO] 2,28 (c, 2H); 3,20 (c, 2H); 4,03 (t, 1H); 7,1-7,4 (m, 11H); 8,35 (d, 1H); 9,0 (a), 13,4 (a, 1H)
100	[CDCl ₃] 3,45-3,55 (a, 4H); 3,75 (m, 4H); 7,03 (d, 1H); 7,80 (d, 1H); 11,3 (a, 1H)
101	[CDCl ₃] 1,65 (m, 6H); 3,52 (m, 4H); 7,10 (d, 1H); 7,72 (d, 1H)
102	[CDCl ₃] 3,06 (t, 2H); 3,90 (m, 2H); 4,65 (m, 2H); 7,08 (d, 1H); 7,90 (d, 1H); 11,0 (a)
103	[CDCl ₃] 2,00 (m, 4H); 3,67 (m, 4H); 7,20 (d, 1H); 7,97 (d, 1H), 11,7 (a, 1H)
104	[CDCl ₃] 1,30 (m, 3H); 1,65 (m, 1H); 1,85 (m, 1H); 2,00 (m, 1H); 2,19 (m, 1H); 3,62 (m, 2H); 4,30 (m, 1H); 7,10 (d, 1H); 7,89 (d, 1H)
105	[CDCl ₃] 3,25 (s, 3H); 3,35 (3, 3H); 7,25 (d, 1H); 8,58 (d, 1H); 8,76 (s, 1H)
112	[CDCl ₃] 1,95 (m, 1H); 2,65 (m, 1H); 2,90 (m, 1H); 3,05 (m, 1H); 5,60 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 7,2-7,4 (m, 4H); 8,68 (d, 1H); 9,52 (d, a, 1H)
113	[CDCl ₃] 1,60 (m, 1H), 1,90 (m, 2H), 2,01 (m, 1H); 3,42 (m, 1H), 3,65-3,82 (m, 2H), 3,90 (m, 1H), 4,09 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,63 (d, 1H); 9,37 (a, 1H)
114	[DMSO] 7,35 (d, 1H); 8,10 (a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,41 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
115	[CDCl ₃] 3,01 (d, 3H); 6,81 (d, 1H); 8,63 (d, 1H); 9,22 (a, 1H); 11,7 (a, 1H)
116	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 3,5 (m, 2H); 6,85 (d, 1H); 8,66 (d, 1H), 9,33 (a, 1H), 13,0 (a, 1H)
117	[CDCl ₃] 1,01 (t, 3H); 1,62 (m, 2H); 3,42 (m, 2H); 6,86 (d, 1H); 8,66 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 12,6 (a, 1H)
118	[CDCl ₃] 1,27 (d, 6H); 4,25 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,27 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
119	[CDCl ₃] 0,62 (m, 2H); 0,85 (m, 2H); 3,02 (m, 1H); 6,84 (d, 1H); 8,78 (d, 1H), 9,33 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
120	[CDCl ₃] 0,98 (t, 3H); 1,41 (m, 2H); 1,61 (m, 2H); 3,45 (c, 2H); 6,83 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,33 (a, 1H); 12,9 (a, 1H)
122	[CDCl ₃] 1,46 (s, 9H); 6,86 (d, 1H); 8,62 (d, 1H); 9,34 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
123	[CDCl ₃] 3,08 (s, 6H); 7,06 (d, 1H); 7,79 (d, 1H)
124	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 3,04 (s, 3H); 3,46 (m, 2H); 7,02 (d, 1H); 7,72 (d, 1H)
125	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,30 (a, 2H); 1,60 (m, 2H); 3,04 (s, 3H); 3,41 (a, 2H); 7,04 (d, 1H); 7,71 (d, 1H)
127	[CDCl ₃] 1,20 (d, 6H); 2,90 (s, 3H); 4,05 (m, a, 1H); 7,00 (d, 1H); 7,68 (d, 1H)
128	[CDCl ₃] 1,20 (t, 6H); 3,41 (m, 4H); 6,98 (d, 1H); 7,66 (d, 1H); 11,0 (a)
130	[CDCl ₃] 1,20 (m, 9H); 3,40 (c, 2H); 4,06 (m, a, 1H); 6,98 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 10,2 (a)
132	[CDCl ₃] 1,5-1,8 (m, 8H); 4,40 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,40 (d, a, 1H); 13,1 (a, 1H)
133	[CDCl ₃] 1,2-1,7 (m, 6H); 1,80 (m, 2H); 2,00 (m, 2H); 3,98 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,0 (a)
134	[CDCl ₃] 0,90 (t, 3H); 1,40 (m, 4H); 1,62 (m, 2H); 3,44 (m, 2H); 6,84 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,30 (a, 1H)
136	[CDCl ₃] 0,30 (m, 2H); 0,59 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,32 (m, 2H); 6,86 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,40 (a)
138	[CDCl ₃] 1,00 (s, 9H); 3,26 (d, 2H); 6,86 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,42 (a, 1H); 12,5 (a, 1H)
139	[DMSO] 4,25 (dt, 2H); 7,25 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
140	[CDCl ₃] 4,15 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,80 (a, 1H)
141	[CDCl ₃] 4,20 (dt, 2H); 6,90 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,83 (t, a, 1H); 12,80 (a)
144	[CDCl ₃] 1,00 (d, 6H); 1,90 (m, 1H); 3,30 (t, 2H); 6,83 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 12,2 (a)
146	[CDCl ₃] 0,96 (d, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,70 (m, 1H); 3,48 (m, 2H); 6,83 (d, 1H); 8,67 (d, 1H); 9,30 (a, 1H); 12,9 (a, 1H)
148	[CDCl ₃] 4,62 (d, 2H); 5,36 (dd, 2H); 5,95 (m, 1H); 7,80 (d, 1H); 8,65 (d, 1H)
150	[CDCl ₃] 4,0 (m, 4H); 5,22 (d, 4H); 5,80 (m, 2H); 6,93 (d, 1H); 7,72 (d, 1H)
152	[CDCl ₃] 1,80 (s, 3H); 4,02 (d, 2H); 4,90 (d, 2H); 6,85 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,48 (a, 1H); 12,8 (a, 1H)
153	[CDCl ₃] 2,26 (t, 1H); 4,23 (m, 2H); 6,84 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,58 (a, 1H); 12,4 (a)
154	[CDCl ₃] 2,30 (s, 1H); 3,12 (s, 3H); 4,24 (a, 2H); 7,01 (d, 1H); 7,82 (d, 1H); 10,9 (a)
155	[CDCl ₃] 0,98 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,59 (m, 2H); 4,10 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,26 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
157	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 4,20 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H)
158	[CDCl ₃] 0,87 (t, 3H); 1,12 (d, 3H); 1,30 (m, 4H); 1,58 (m, 4H); 4,15 (m, 1H); 6,84 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,24 (a, 1H); 13,1 (a)
161	[CDCl ₃] 0,90 (d, 6H); 1,22 (d, 3H); 1,30 (m, 1H); 1,55 (m, 2H); 4,23 (m, 1H); 6,86 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,20 (d, a, 1H); 13,0 (a, 1H)
162	[CDCl ₃] 0,98 (s, 9H); 1,20 (d, 3H); 4,10 (m, 1H); 6,87 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,38 (d, a, 1H); 13,2 (a, 1H)
163	[CDCl ₃] 0,95 (dt, 6H); 1,20 (d, 3H); 1,82 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 6,84 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,1 (a)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
165	[CDCl ₃] 0,96 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,22 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
166	(CDCl ₃) 0,90 (t, 3H); 1,41 (s; 6H); 1,85 (c, 2H); 6,82 (d, 1H); 8,61 (d, 1H); 9,20 (a, 1H); 13,1 (a)
168	[CDCl ₃] 3,40 (s, 6H); 3,63 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 6,85 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,40 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
169	[CDCl ₃] 1,21 (t, 6H); 3,60 (m, 4H); 3,74 (m, 2H); 4,62 (t, 1H); 6,84 (d, 1H); 8,60 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 11,5 (a)
171	[CDCl ₃] 3,40 (s, 3H); 3,58 (m, 2H); 3,67 (m, 2H); 6,84 (d, 1H); 8,62 (d, 1H); 9,40 (a, 1H)
178	[CDCl ₃] 1,24 (d, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,42 (d, 2H); 4,40 (m, 1H); 6,86 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 13,0 (a)
180	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,22 (s, 3H); 3,36 (m, 4H); 7,3 (a, 1H); 8,4 (d, 1H); 9,0 (a); 13,4 (a, 1H)
185	[DMSO] 3,65 (s, 3H); 4,12 (d, 2H); 7,28 (d, a, 1H); 8,42 (d, 1H); 9,25 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
189	[CDCl ₃] 2,66 (t, 2H); 3,70 (s, 3H); 3,76 (m, 2H); 6,83 (d, 1H); 8,61 (d, 1H); 9,51 (t, a, 1H); 12,4 (a, 1H)
193	[CDCl ₃] 1,37 (t, 3H); 4,08 (c, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,69 (d, 1H); 11,48 (s, 1H)
194	[CDCl ₃] 3,88 (s, 3H); 6,88 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 11,5 (s, 1H)
195	[CDCl ₃] 4,50 (d, 2H); 5,34 (m, 2H); 6,05 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 11,44 (s, 1H)
196	[CDCl ₃] 1,39 (s, 9H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 11,22 (s, 1H)
206	[CDCl ₃] 4,62 (d, 2H); 6,82 (d, 1H); 7,2-7,3 (m, 5H); 8,68 (d, 1H); 9,65 (t, a, 1H); 12,8 (a, 1H)
207	[CDCl ₃] 2,99 (s, 3H); 4,67 (a, 2H); 7,00 (d, 1H); 7,3-7,4 (m, 5H); 7,78 (d, 1H); 10,2 (a)
210	[CDCl ₃] 1,60 (d, 3H); 5,30 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 7,2-7,4 (m, 5H); 8,65 (d, 1H); 9,78 (d, a, 1H); 13,2 (a, 1H)
211	[CDCl ₃] 2,95 (t, 2H); 3,70 (m, 2H); 6,82 (d, 1H); 7,2-7,35 (m, 5H); 8,63 (d, 1H); 9,40 (t, a, 1H); 12,2 (a, 1H)
214	[CDCl ₃] 3,45-3,55 (a, 4H); 3,75 (m, 4H); 6,96 (d, 1H); 7,78 (d, 1H)
215	[CDCl ₃] 1,65 (m, 6H); 3,53 (m, 4H); 7,00 (d, 1H); 7,70 (d, 1H)
216	[CDCl ₃] 3,05 (t, 2H); 3,92 (m, 2H); 4,66 (m, 2H); 7,04 (d, 1H); 7,86 (d, 1H); 10,4 (a)
217	[CDCl ₃] 2,00 (m, 4H); 3,70 (m, 4H); 7,16 (d, 1H); 7,97 (d, 1H); 11,7 (a, 1H)
218	[CDCl ₃] 1,30 (m, 3H); 1,65 (m, 1H); 1,85 (m, 1H); 2,04 (m, 1H); 2,20 (m, 1H); 3,63 (m, 2H); 4,33 (m, 1H); 7,12 (d, 1H); 7,89 (d, 1H); 11,5 (a, 1H)
227	[CDCl ₃] 1,60 (m, 1H); 1,90 (m, 2H); 2,00 (m, 1H); 3,42 (m, 1H); 3,65-3,82 (m, 2H); 3,90 (m, 1H); 4,10 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,5 (a, 1H)
228	[DMSO] 6,80 (a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,72 (a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,90 (a, 1H); 13,20 (a, 1H)
229	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 6,75 (d, a, 1H); 6,90 (t, 1H); 8,89 (d, 1H); 9,50 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
230	[DMSO] 1,11 (t, 3H); 3,32 (m, 2H); 6,75 (d, a, 1H); 6,90 (t, 1H); 8,39 (d, 1H); 9,60 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
232	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,22 (m, 1H); 6,55 (t, 1H); 6,69 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,42 (d, a, 1H); 13,0 (a, 1H)
233	[DMSO] 0,51 (m, 2H); 0,74 (m, 2H); 2,84 (m, 1H); 6,79 (d, a, 1H); 6,90 (t, 1H); 8,37 (d, 1H); 9,65 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
250	[DMSO] 0,23 (m, 2H); 0,46 (m, 2H); 1,02 (m, 1H); 3,20 (m, 2H); 6,75 (a, 1H); 6,92 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,70 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
252	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 3,15 (d, 2H); 6,80 (a, 1H); 6,91 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,85 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
258	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,80 (m, 1H); 3,15 (t, 2H); 6,80 (a, 1H); 6,91 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,73 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
262	[DMSO] 3,96 (m, 2H); 5,15 (dd, 2H); 5,94 (m, 1H); 6,80 (a, 1H); 6,92 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,75 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
271	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,25 (d, 3H); 1,42 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 4,19 (m, 1H); 6,60 (t, 1H); 6,73 (d, 1H); 8,66 (d, 1H); 9,50 (d, a, 1H)
272	[CDCl ₃] 0,90 (t, 3H); 1,2-1,4 (m, 9H); 1,58 (m, 2H); 4,17 (m, 1H); 6,60 (t, 1H); 6,75 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,48 (d, a, 1H)
279	[CDCl ₃] 0,85 (t, 6H); 1,45 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,80 (m, 1H); 6,80 (a, 1H); 6,91 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,51 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
280	[DMSO] 0,86 (t, 3H); 1,12 (d, 3H); 1,50 (m, 2H); 3,90 (m, 1H); 6,75 (a, 1H); 6,91 (t, 1H); 8,39 (d, 1H); 9,57 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
285	[DMSO] 3,29 (s, 3H); 3,46 (m, 4H); 6,76 (a, 1H); 6,91 (t, 1H); 8,50 (d, 1H); 9,73 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
291	[DMSO] 1,14 (d, 3H); 3,27 (s, 3H); 3,35 (m, 2H); 4,15 (m, 1H); 6,80 (a, 1H); 6,91 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,70 (a, 1H); 13,1 (a, 1H)
293	[DMSO] 1,72 (m, 2H); 3,22 (s, 3H); 3,37 (m, 4H); 6,75 (a, 1H); 6,90 (t, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,70 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
341	[DMSO] 7,45 (d, 1H); 8,15 (a, 1H); 8,45 (a, 1H); 8,50 (d, 1H); 13,7 (a, 1H)
342	[CDCl ₃] 3,01 (d, 3H); 6,90 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,34 (a, 1H)
343	[DMSO] 1,11 (t, 3H); 3,31 (m, 2H); 7,41(d, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,85 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
344	[CDCl ₃] 1,02 (t, 3H); 1,61 (m, 2H); 3,42 (c, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,38 (a, 1H)
345	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,25 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,8 (a, 1H)
346	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,88 (m, 2H); 3,02 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,42 (a, 1H); 13,4 (a)
347	[DMSO] 0,88 (t, 3H); 1,34 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,31 (c, 2H); 7,27 (d, 1H); 8,35 (d, 1H); 9,21 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
348	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,02 (m, 2H); 2,27 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 7,41 (d, 1H); 8,48 (d, 1H); 9,00 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
349	[DMSO] 1,36 (s, 9H); 7,35 (d, a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,60 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
350	[CDCl ₃] 3,08 (s, 6H); 7,08 (d, 1H); 7,81 (d, 1H)
355	[CDCl ₃] 1,21 (t, 6H); 3,42 (m, 4H); 7,04 (d, 1H); 7,71 (d, 1H); 10,8 (a)
363	[DMSO] 0,27 (m, 2H); 0,46 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,15 (m, 2H); 7,45 (d, a, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,95 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
365	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 3,15 (d, 2H); 7,38 (d, a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,83 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
373	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,42 (m, 2H); 1,63 (m, 1H); 3,33 (m, 2H); 7,40 (d, a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,83 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
375	[DMSO] 3,95 (m, 2H); 5,15 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 7,40 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,98 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
379	[DMSO] 1,73 (s, 3H); 3,88 (m, 2H); 4,75 (d, 2H); 7,40 (d, a, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,97 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
380	[DMSO] 3,15 (t, 1H); 4,21 (m, 2H); 7,40 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,12 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
382	[CDCl ₃] 0,97 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,59 (m, 2H); 4,10 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,24 (d, a, 1H); 13,6 (a)
384	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 4,20 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,28 (d, a, 1H)
385	[DMSO] 0,85 (t, 3H); 1,1-1,35 (m, 9H); 1,50 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 7,41 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,65 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
388	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,28 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,62 (m, 1H); 4,11 (m, 1H); 7,40 (d, a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,52 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
389	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 1,10 (d, 3H); 3,90 (m, 1H); 7,38 (d, a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,70 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
390	[DMSO] 0,79 (dt, 6H); 1,10 (d, 3H); 1,75 (m, 1H); 3,87 (m, 1H); 7,40 (d, a, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,65 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
392	[CDCl ₃] 0,95 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 6,90 (d, 1H); 8,75 (d, 1H); 9,20 (d, a, 1H); 13,7 (a, 1H)
395	[DMSO] 3,30 (s, 6H); 3,42 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 7,40 (d, a, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,90 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
397	[DMSO] 3,38 (m, 2H); 3,52 (m, 2H); 4,80 (t, 1H); 7,40 (d, a, 1H); 8,43 (d, 1H); 8,95 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
398	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,58 (m, 2H); 3,65 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,43 (a, 1H)
405	[CDCl ₃] 1,25 (d, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 2H); 4,40 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,38 (d, a, 1H)
407	[CDCl ₃] 1,89 (m, 2H); 3,32 (s, 3H); 3,48 (t, 2H); 3,58 (m, 2H); 6,92 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,30 (a, 1H)
455	[DMSO] 8,25 (a, 1H); 8,35 (a, 1H); 8,50 (s, 1H); 13,8 (a, 1H)
456	[DMSO] 2,84 (d, 3H); 8,40 (s, 1H); 8,72 (d, a, 1H)
457	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,35 (c, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
458	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,25 (m, 2H); 8,41 (s, 1H); 8,73 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
459	[DMSO] 1,19 (d, 6H); 4,08 (m, 1H); 8,43 (s, 1H); 8,59 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
460	[DMSO] 0,59 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,87 (m, 1H); 8,39 (s, 1H); 8,73 (d, a, 1H)
461	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,32 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,30 (m, 2H); 8,41 (s, 1H); 8,74 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
462	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,03 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 8,90 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
477	[DMSO] 0,25 (m, 2H); 0,47 (m, 2H); 1,02 (m, 1H); 3,19 (t, 2H); 8,45 (s, 1H); 8,80 (t, a, 1H)
479	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 3,14 (d, 2H); 8,38 (s, 1H); 8,60 (t, a, 1H); 13,7 (a, 1H)
485	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,82 (m, 1H); 3,13 (t, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,72 (t, a, 1H)
487	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,41 (c, 2H); 1,62 (m, 1H); 3,32 (m, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,72 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
489	[CDCl ₃] 4,10 (d, 2H); 5,25 (dd, 2H); 5,93 (m, 1H); 8,60 (s, 1H); 9,10 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
493	[DMSO] 1,71 (s, 3H); 3,86 (d, 2H); 4,84 (d, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H); 13,5 (a)
494	[DMSO] 3,17 (m, 1H); 4,11 (m, 2H); 8,39 (s, 1H); 8,98 (t, a, 1H); 13,4 (a)
496	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,25 (d, 3H); 1,60 (m, 2H); 4,12 (m, 1H); 8,48 (s, 1H); 8,52 (a, 1H)
498	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,25 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 4,17 (m, 1H); 8,53 (s, 1H); 8,70 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
502	[CDCl ₃] 0,91 (d, 6H); 1,23 (d, 3H); 1,35 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,66 (m, 1H); 4,25 (m, 1H); 8,62 (s, 1H); 8,96 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
504	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,18 (d, 3H); 1,81 (m, 1H); 4,07 (m, 1H); 8,61 (s, 1H); 8,97 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
506	[CDCl ₃] 0,94 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 8,56 (s, 1H); 8,73 (d, a, 1H)
512	[DMSO] 3,28 (s, 3H); 3,48 (m, 4H); 8,42 (s, 1H); 8,78 (a, 1H); 13,7 (a, 1H)
519	[DMSO] 1,16 (d, 3H); 3,30 (s, 3H); 3,42 (m, 2H); 4,18 (m, 1H); 8,42 (s, 1H); 8,60 (d, a, 1H); 13,7 (a, 1H)
521	[DMSO] 1,74 (m, 2H); 3,26 (s, 3H); 3,39 (m, 4H); 8,40 (s, 1H); 8,80 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
569	[DMSO] 8,25 (a, 1H); 8,35 (a, 1H); 8,50 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
570	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 8,40 (s, 1H); 8,71 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
571	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,35 (c, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,7 (a, 1H)
572	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,26 (m, 2H); 8,39 (s, 1H); 8,82 (a, 1H)
573	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,09 (m, 1H); 8,42 (s, 1H); 8,53 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
574	[DMSO] 0,59 (m, 2H); 0,74 (m, 2H); 2,85 (m, 1H); 8,37 (s, 1H); 8,72 (d, a, 1H)
575	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,35 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,35 (m, 2H); 8,39 (s, 1H); 8,75 (a, 1H)
576	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 8,40 (s, 1H); 8,94 (a, 1H)
591	[DMSO] 0,25 (m, 2H); 0,45 (m, 2H); 1,03 (m, 1H); 3,21 (t, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,84 (a, 1H)
599	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,82 (m, 1H); 3,14 (m, 2H); 8,38 (s, 1H); 8,74 (a, 1H)
601	[CDCl ₃] 0,96 (d, 6H); 1,51 (m, 2H); 1,70 (m, 1H); 3,49 (m, 2H); 8,59 (s, 1H); 9,02 (a, 1H); 12,2(a)
603	[DMSO] 3,95 (t, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,40 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
612	[CDCl ₃] 0,91 (t, 3H); 1,24 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,54 (m, 2H); 4,18 (m, 1H); 8,57 (s, 1H); 8,90 (d, a, 1H); 12,2 (a, 1H)
620	[CDCl ₃] 0,94 (t, 6H); 1,51 (m, 2H); 1,67 (m, 2H); 3,99 (m, 1H); 8,57 (s, 1H); 8,82 (d, a, 1H)
626	[DMSO] 3,29 (s, 3H); 3,48 (m, 4H); 8,41 (s, 1H); 8,78 (a, 1H); 13,7 (a, 1H)
633	[CDCl ₃] 1,28 (d, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,37 (m, 1H); 8,48 (s, 1H); 8,78 (a, 1H)
635	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,25 (s, 3H); 3,39 (m, 4H); 8,40 (s, 1H); 8,81 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
797	[DMSO] 8,27 (a, 1H); 8,38 (a, 1H); 8,52 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
798	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 8,40 (s, 1H); 8,75 (d, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
799	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,33 (m, 2H); 8,41 (s, 1H); 8,78 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
800	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,27 (c, 2H); 8,41 (s, 1H); 8,76 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
801	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,09 (m, 1H); 8,42 (s, 1H); 8,60 (d, a, 1H)
802	[DMSO] 0,55 (m, 2H); 0,75, (m, 2H); 2,85 (m, 1H); 8,31 (s, 1H); 9,24 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
803	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,33 (m, 2H); 1,51 (m, 2H); 3,30 (m, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H), 13,4 (a)
804	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,04 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 8,43 (s, 1H); 8,95 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
806	[DMSO] 2,82 (s, 3H); 2,98 (s, 3H); 8,06 (s, 1H); 12,6 (s, a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
819	[DMSO] 0,25 (m, 2H); 0,46 (m, 2H); 1,03 (m, 1H); 3,20 (t, 2H); 8,45 (s, 1H); 8,87 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
821	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 3,13 (d, 2H); 8,37 (s, 1H); 8,61 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
827	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,82 (m, 1H); 3,13 (t, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,76 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
829	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,42 (m, 2H); 1,61 (m, 1H); 3,30 (m, 2H); 8,41 (s, 1H); 8,76 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
831	[DMSO] 3,95 (t, 2H); 5,19 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 8,88 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
835	[DMSO] 1,72 (s, 3H); 3,87 (d, 2H); 4,86 (d, 2H); 8,39 (s, 1H); 8,90 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
836	[DMSO] 3,18 (m, 1H); 4,10 (m, 2H); 8,36 (s, 1H); 9,01 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
838	[DMSO] 0,88 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,51 (m, 2H); 3,91 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 8,54 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
840	[DMSO] 0,88 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,33 (m, 2H); 1,47 (m, 2H); 4,01 (m, 1H); 8,42 (s, 1H); 8,53 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
841	[DMSO] 0,85 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,28 (m, 6H); 1,49 (m, 2H); 3,98 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 8,60 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
844	[DMSO] 0,87 (d, 6H); 1,14 (d, 3H); 1,27 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,62 (m, 1H); 4,09 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 8,52 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
845	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 1,08 (d, 3H); 3,90 (m, 1H); 8,35 (s, 1H); 8,38 (d, a, 1H); 13,4 (a)
846	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,12 (d, 3H); 1,75 (m, 1H); 3,87 (m, 1H); 8,40 (s, 1H); 8,50 (d, a, 1H); 13,5 (a)
848	[DMSO] 0,87 (t, 6H); 1,44 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,79 (m, 1H); 8,40 (s, 1H); 8,42 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
851	[CDCl ₃] 3,42 (s, 6H); 3,63 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,55 (s, 1H); 8,95 (t, a, 1H); 12,1 (a, 1H)
853	[CDCl ₃] 3,65 (m, 2H); 3,86 (m, 2H); 8,47 (s, 1H); 8,98 (a, 1H)
854	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,58 (m, 2H); 3,69 (m, 2H); 8,49 (s, 1H); 8,80 (a, 1H); 11,9 (a, 1H)
861	[CDCl ₃] 1,28 (d, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 8,51 (s, 1H); 8,85 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
863	[CDCl ₃] 1,90 (m, 2H); 3,40 (s, 3H); 3,57 (m, 4H); 8,30 (s, 1H); 8,70 (a, 1H)
868	[CDCl ₃] 3,80 (s, 3H); 4,25 (d, 2H); 8,52 (s, 1H); 9,16 (a, 1H)
909	[DMSO] 8,22 (a, 1H); 8,32 (a, 1H); 8,61 (s, 1H); 13,8 (a, 1H)
910	[DMSO] 2,83 (d, 3H); 8,51 (s, 1H); 8,74 (a, 1H); 13,7 (a, 1H)
911	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,32 (c, 2H); 8,54 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,7 (a, 1H)
912	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,25 (c, 2H); 8,54 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
913	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,25 (m, 1H); 8,54 (a, 1H); 8,70 (s, 1H)
914	[DMSO] 0,58 (m, 2H); 0,75, (m, 2H); 2,86 (m, 1H); 8,50 (s, 1H); 8,75 (d, 1H); 13,6 (a, 1H)
915	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,32 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,32 (m, 2H); 8,53 (s, 1H); 8,74 (t, a, 1H); 13,5 (a)
916	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,98 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
917	[CDCl ₃] 1,50 (s, 9H); 8,65 (s, 1H); 8,80 (s, a, 1H); 12,3 (a, 1H)
918	[DMSO] 2,82 (s, 3H); 2,99 (s, 3H); 8,14 (s, 1H); 12,6 (a, 1H)
923	[DMSO] 1,02 (t, 3H); 1,12 (t, 3H); 3,10 (c, 2H); 3,40 (c, 2H); 8,15 (s, 1H); 12,5 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
933	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 3,13 (d, 2H); 8,50 (s, 1H); 8,61 (t, a, 1H)
939	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,83 (m, 1H); 3,14 (t, 2H); 8,52 (s, 1H); 8,72 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
941	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,43 (m, 2H); 1,62 (m, 1H); 3,35 (m, 2H); 8,52 (s, 1H); 8,72 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
943	[DMSO] 3,94 (t, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H)
947	[DMSO] 1,72 (s, 3H); 3,87 (d, 2H); 4,85 (d, 2H); 8,51 (s, 1H); 8,87 (t, a, 1H); 13,5 (a)
948	[DMSO] 3,18 (m, 1H); 4,12 (m, 2H); 8,50 (s, 1H); 9,00 (t, a, 1H)
950	[DMSO] 0,92 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,57 (m, 2H); 3,97 (m, 1H); 8,55 (d, a, 1H); 8,60 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
952	[CDCl ₃] 0,90 (t, 3H); 1,24 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 4,18 (m, 1H); 8,72 (s, 1H); 8,90 (d, a, 1H)
953	[DMSO] 0,77 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,27 (m, 6H); 1,49 (m, 2H); 3,99 (m, 1H); 8,50 (d, a, 1H); 8,55 (s, 1H); 13,6 (a)
956	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,27 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,62 (m, 1H); 4,10 (m, 1H); 8,50 (d, a, 1H); 8,55 (s, 1H); 13,6 (a, 1H)
957	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 1,09 (d, 3H); 3,80 (m, 1H); 8,39 (d, a, 1H); 8,49 (s, 1H); 13,6 (a, 1H)
958	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,11 (d, 3H); 1,75 (m, 1H); 3,86 (m, 1H); 8,48 (d, a, 1H); 8,52 (s, 1H); 13,6 (a)
960	[CDCl ₃] 0,95 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,62 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 8,73 (s, 1H); 8,90 (d, a, 1H)
963	[CDCl ₃] 3,43 (s, 6H); 3,65 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,62 (s, 1H); 8,78 (a, 1H)
965	[DMSO] 3,40 (m, 2H); 3,52 (m, 2H); 8,57 (s, 1H); 8,78 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
966	[DMSO] 3,29 (s, 3H); 3,48 (m, 4H); 8,54 (s, 1H); 8,78 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
973	[CDCl ₃] 1,29 (d, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,36 (m, 1H); 8,60 (s, 1H); 8,72 (a, 1H)
975	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,20 (s, 3H); 3,38 (m, 4H); 8,51 (s, 1H); 8,81 (t, a, 1H); 13,6 (a)
1023	[DMSO] 8,22 (a, 1H); 8,35 (a, 1H); 8,61 (s, 1H); 13,8 (a, 1H)
1024	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 8,50 (s, 1H); 8,75 (a, 1H); 13,7 (a, 1H)
1025	[DMSO] 1,13 (t, 3H); 3,35 (m, 2H); 8,52 (s, 1H); 8,75 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1026	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,53 (m, 2H); 3,25 (m, 2H); 8,52 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1027	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,08 (m, 1H); 8,54 (s, 1H); 8,56 (a, 1H)
1028	[DMSO] 0,58 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 3,86 (m, 1H); 8,48 (s, 1H); 8,75 (a, 1H)
1029	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,34 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,26 (m, 2H); 8,51 (s, 1H); 8,81 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
1030	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,04 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 8,53 (s, 1H); 8,91 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1031	[CDCl ₃] 1,46 (s, 9H); 8,63 (s, 1H); 8,83 (a, 1H); 111,9 (a, 1H)
1032	[DMSO] 2,82 (s, a, 3H); 2,96 (s, a, 3H); 8,11 (s, 1H); 12,5 (a, 1H)
1037	[CDCl ₃] 1,23 (t, 6H); 3,42 (a, 4H); 7,88 (s, 1H)
1045	[DMSO] 0,25 (m, 2H); 0,46 (m, 2H); 1,04 (m, 1H); 3,20 (t, 2H); 8,55 (s, 1H); 8,82 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
1047	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 3,13 (d, 2H); 8,48 (s, 1H); 8,61 (t, a, 1H)
1053	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,82 (m, 1H); 3,13 (m, 2H); 8,50 (s, 1H); 8,75 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1057	[DMSO] 3,95 (t, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 8,50 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H)
1061	[CDCl ₃] 1,80 (s, 3H); 4,03 (d, 2H); 4,93 (d, 2H); 8,76 (s, 1H); 9,22 (t, a, 1H);
1062	[DMSO] 3,18 (m, 1H); 4,10 (m, 2H); 8,48 (s, 1H); 9,00 (a, 1H)
1064	[DMSO] 0,88 (t, 3H); 1,16 (d, 3H); 1,51 (m, 2H); 3,93 (m, 1H); 8,50 (d, a, 1H); 8,55 (s, 1H); 13,6 (a, 1H)
1066	[DMSO] 0,86 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,30 (m, 2H); 1,48 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 8,50 (d, a, 1H); 8,52 (s, 1H); 13,6 (a, 1H)
1067	[CDCl ₃] 0,86 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,25 (m, 6H); 1,48 (m, 2H); 4,16 (m, 1H); 8,62 (s, 1H); 8,68 (a, 1H)
1070	[CDCl ₃] 0,93 (d, 6H); 1,23 (d, 3H); 1,27 (m, 1H); 1,50 (m, 1H); 1,70 (m, 1H); 4,25 (m, 1H); 8,63 (a, 2H)
1071	[CDCl ₃] 0,95 (s, 9H); 1,17 (d, 3H); 4,08 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 9,00 (d, a, 1H)
1072	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,20 (d, 3H); 1,82 (m, 1H); 4,07 (m, 1H); 8,76 (s, 1H); 9,13 (a, 1H)
1074	[CDCl ₃] 0,92 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 3,96 (m, 1H); 8,72 (s, 1H); 9,00 (d, a, 1H)
1077	[CDCl ₃] 3,42 (s, 6H); 3,62 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,62 (s, 1H); 8,90 (a, 1H)
1079	[CDCl ₃] 3,65 (m, 2H); 3,85 (m, 2H); 8,64 (s, 1H); 9,22 (a, 1H)
1080	[DMSO] 3,30 (s, 3H); 3,46 (m, 4H); 8,52 (s, 1H); 8,75 (a, 1H)
1087	[CDCl ₃] 1,29 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,37 (m, 1H); 8,66 (s, 1H); 8,98 (a, 1H); 12,50 (a, 1H)
1089	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,23 (s, 3H); 3,38 (m, 4H); 8,52 (s, 1H); 8,80 (t, a, 1H)
1094	[CDCl ₃] 3,80 (s, 3H); 4,24 (d, 2H); 8,61 (s, 1H); 9,19 (a, 1H)
1138	[DMSO] 2,83 (d, 3H); 7,07 (t, 1H); 8,40 (s, 1H); 8,94 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1139	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,33 (m, 2H); 7,08 (t, 1H); 8,40 (s, 1H); 9,00 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1171	[DMSO] 3,90 (t, 2H); 5,15 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 7,10 (t, 1H); 8,40 (s, 1H); 9,16 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1178	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,58 (m, 2H); 4,08 (m, 1H); 6,86 (t, 1H); 8,70 (s, 1H); 9,34 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1180	[CDCl ₃] 0,93 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,52 (m, 2H); 4,16 (m, 1H); 6,87 (t, 1H); 8,70 (s, 1H); 9,31 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1188	[CDCl ₃] 0,92 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 3,98 (m, 1H); 6,86 (t, 1H); 8,71 (s, 1H); 9,28 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1201	[CDCl ₃] 1,27 (d, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,43 (m, 2H); 4,37 (m, 1H); 6,85 (t, 1H); 8,68 (s, 1H); 9,42 (d, a, 1H); 12,7 (a, 1H)
1251	[DMSO] 8,26 (a, 1H), 8,42 (a, 1H); 8,62 (s, 1H)
1252	[CDCl ₃] 3,00 (d, 3H); 8,66 (s, 1H); 8,82 (a, 1H)
1253	[CDCl ₃] 1,24 (t, 3H); 3,50 (m, 2H); 8,68 (s, 1H); 8,86 (a, 1H)
1254	[CDCl ₃] 1,00 (t, 3H); 1,62 (m, 2H); 3,42 (m, 2H); 8,67 (s, 1H); 8,90 (a, 1H)
1255	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,25 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,84 (a, 1H)
1256	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,89, (m, 2H); 3,00 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 9,00 (a, 1H)
1257	[CDCl ₃] 0,96 (t, 3H); 1,42, (m, 2H); 1,60 (m, 2H); 3,45 (m, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,88 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1258	[CDCl ₃] 1,77 (m, 2H); 1,98, (m, 2H); 2,43 (m, 2H); 4,55 (m, 1H); 8,68 (s, 1H); 9,13 (a, 1H); 12,5 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1260	[CDCl ₃] 3,11 (s, 6H); 7,95 (s, 1H)
1265	[CDCl ₃] 1,25 (t, 6H); 3,45 (a, 4H); 7,89 (s, 1H)
1273	[CDCl ₃] 0,27 (m, 2H); 0,56, (m, 2H); 1,04 (m, 1H); 3,32 (m, 2H); 8,67 (s, 1H); 8,92 (a, 1H); 12,3 (a, 1H)
1275	[CDCl ₃] 0,97 (s, 9H); 3,29 (d, 2H); 8,73 (s, 1H); 9,00 (a, 1H); 11,9 (a, 1H)
1281	[CDCl ₃] 0,98 (d, 6H); 1,89 (m, 1H); 3,29 (t, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,98 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1283	[CDCl ₃] 0,95 (d, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,68 (m 1H); 3,46 (m, 2H); 8,69 (s, 1H); 8,83 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1285	[CDCl ₃] 4,09 (t, 2H); 5,22 (dd, 2H); 5,91 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 9,01 (a, 1H); 12,2 (a, 1H)
1289	[DMSO] 0,26 (m, 2H); 0,47 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,20 (m, 2H); 6,85 (tt, 1H); 7,25 (a, 1H); 8,45 (d, 1H); 9,15 (a, 1H), 13,4 (a, 1H)
1290	[CDCl ₃] 2,25 (m, 1H); 4,23 (m, 2H); 8,72 (s, 1H); 9,20 (a, 1H), 12,0 (a, 1H)
1292	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,55 (m 2H); 4,10 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,82 (a, 1H)
1294	[CDCl ₃] 0,93 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,38 (m, 2H); 1,52 (m 2H); 4,18 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,79 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
1295	[CDCl ₃] 0,89 (t, 3H); 1,20 (d, 3H); 1,25-1,4 (m, 6H); 1,50 (m, 2H); 4,16 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,75 (a, 1H)
1298	[CDCl ₃] 0,92 (t, 6H); 1,40 (d, 3H); 1,32 (m, 1H); 1,45 (m, 1H); 1,55 (m, 1H); 4,25 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,75 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
1299	[CDCl ₃] 0,95 (s, 9H); 1,15 (d, 3H); 4,10 (m, 1H); 8,72 (s, 1H); 8,88 (a, 1H); 11,9 (a, 1H)
1300	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,77 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 8,71 (s, 1H); 8,85 (a, 1H)
1302	[CDCl ₃] 0,93 (t, 6H); 1,48 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 3,99 (m, 1H); 8,71 (s, 1H); 8,76 (a, 1H); 12,4 (a, 1H)
1305	[CDCl ₃] 3,40 (s, 6H); 3,62 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,60 (s, 1H); 8,74 (a, 1H); 11,7 (a, 1H)
1307	[CDCl ₃] 3,65 (m, 2H); 3,87 (m, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,66 (s, 1H); 9,11 (a, 1H)
1308	[CDCl ₃] 3,40 (s, 3H); 3,58 (m, 2H); 3,67 (m, 2H); 8,60 (s, 1H); 8,75 (a, 1H); 11,7 (a, 1H)
1315	[CDCl ₃] 1,48 (d, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,44 (m, 2H); 4,38 (m, 1H); 8,62 (s, 1H); 8,72 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1317	[CDCl ₃] 1,90 (m, 2H); 3,40 (s, 3H); 3,58 (m, 4H); 8,39 (s, 1H); 8,62 (a, 1H)
1322	[CDCl ₃] 3,79 (s, 3H); 4,25 (d, 2H); 8,65 (s, 1H); 9,18 (a, 1H)
1365	[DMSO] 8,24 (a, 1H), 8,42 (a, 1H); 8,81 (s, 1H); 13,6 (a, 1H)
1366	[DMSO] 8,19 (a, 1H), 8,34 (a, 1H); 8,78 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
1368	[DMSO] 2,83 (d, 3H); 6,81 (tt, 1H); 7,22 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,00 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1369	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,35 (m, 2H); 6,85 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,20 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1370	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,27 (c, 2H); 6,82 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,20 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1371	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,09 (m, 1H); 6,82 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,95 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1372	[DMSO] 0,56 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,85 (m, 1H); 6,83 (tt, 1H); 7,21 (a, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,05 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1373	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,32 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,30 (c, 2H); 6,84 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,10 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1391	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 3,16 (d, 2H); 6,82 (tt, 1H); 7,10 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,20 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1397	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,82 (m, 1H); 3,15 (m, 2H); 6,82 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,15 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1401	[DMSO] 3,95 (m, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,92 (m, 1H); 6,82 (tt, 1H); 7,20 (d, 1H); 8,42 (d, 1H); 9,20 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1406	[DMSO] 3,15 (t, 1H); 4,13 (m, 2H); 6,82 (tt, 1H); 7,18 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1408	[DMSO] 0,87 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,51 (m, 2H); 3,92 (m, 1H); 6,82 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,90 (a, 1H), 13,4 (a, 1H)
1410	[DMSO] 0,86 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,30 (m, 2H); 1,48 (m, 2H); 4,02 (m, 1H); 6,83 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,90 (a, 1H), 13,4 (a, 1H)
1411	[DMSO] 0,88 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,27 (m, 6H); 1,49 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 6,82 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,92 (a, 1H), 13,4 (a, 1H)
1414	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,28 (m, 1H); 1,46 (m, 1H); 1,60 (m, 1H); 4,10 (m, 1H); 6,81 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,90 (a, 1H), 13,4 (a, 1H)
1418	[CDCl ₃] 0,93 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 6,83 (d, 1H); 8,69 (d, 1H); 9,21 (d, a, 1H); 13,0 (a, 1H)
1421	[CDCl ₃] 3,41 (s, 6H); 3,52 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 6,12 (tt, 1H); 6,81 (d, 1H); 8,64 (d, 1H); 9,41 (a, 1H); 12,5 (a, 1H)
1424	[CDCl ₃] 3,37 (s, 3H); 3,56 (m, 2H); 3,67 (m, 2H); 6,11 (tt, 1H); 6,84 (d, 1H); 8,65 (d, 1H); 9,46 (a, 1H); 12,2 (a, 1H)
1431	[CDCl ₃] 1,28 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 6,10 (tt, 1H); 6,83 (d, 1H); 8,67 (d, 1H); 9,39 (d, a, 1H); 13,0 (a, 1H)
1433	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,24 (s, 3H); 3,38 (m, 4H); 6,83 (tt, 1H); 7,20 (a, 1H); 8,42 (d, 1H); 9,15 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1481	[DMSO] 7,42 (a, 1H); 8,10 (a, 1H); 8,40 (a, 1H); 8,46 (d, 1H), 13,6 (a, 1H)
1482	[CDCl ₃] 3,01 (d, 3H); 6,88 (d, 1H); 8,67 (d, 1H); 9,34 (a, 1H); 12,5 (a, 1H)
1483	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 3,50 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,32 (a, 1H); 12,6 (a, 1H)
1484	[CDCl ₃] 1,00 (t, 3H); 1,63 (m, 2H); 3,41 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,38 (a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1485	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,27 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1486	[CDCl ₃] 0,62 (m, 2H); 0,86 (m, 2H); 3,01 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,41 (a, 1H); 12,6 (a, 1H)
1487	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,44 (m, 2H); 1,61 (m, 2H); 3,45 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,35 (t, a, 1H); 12,7 (a, 1H)
1488	[CDCl ₃] 1,78 (m, 2H); 2,00 (m, 2H); 2,42 (m, 2H); 4,58 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,60 (d, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1503	[CDCl ₃] 0,26 (m, 2H); 0,55 (m, 2H); 1,06 (m, 1H); 3,33 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,45 (a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1505	[CDCl ₃] 0,98 (s, 9H); 3,30 (d, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,43 (t, a, 1H); 12,5 (a, 1H)
1511	[CDCl ₃] 0,98 (d, 6H); 1,90 (m, 1H); 3,30 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,42 (t, a, 1H)
1513	[CDCl ₃] 0,85 (d, 6H); 1,51 (m, 2H); 1,70 (m, 1H); 3,47 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,32 (t, a, 1H); 12,7 (a, 1H)
1515	[CDCl ₃] 4,10 (t, 2H); 5,25 (dd, 2H); 5,91 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,47 (a, 1H); 12,8 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1520	[DMSO] 3,15 (m, 1H); 4,12 (m, 2H); 7,36 (d, a, 1H); 8,42 (d, 1H); 9,15 (a, 1H), 13,4 (a, 1H)
1522	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,59 (m, 2H); 4,11 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,28 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1524	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,23 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,52 (m, 2H); 4,20 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,27 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1525	[CDCl ₃] 0,88 (t, 3H); 1,23 (d, 3H); 1,25-1,4 (m, 6H); 1,55 (m, 2H); 4,18 (m, 1H); 7,89 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,28 (a, 1H); 13,2 (a, 1H)
1528	[CDCl ₃] 0,92 (d, 6H); 1,22 (d, 3H); 1,35 (m, 1H); 1,50 (m, 1H); 1,68 (m, 1H); 4,28 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,26 (d, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1529	[CDCl ₃] 0,95 (s, 9H); 1,17 (d, 3H); 4,12 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,73 (d, 1H); 9,30 (d, a, 1H), 12,8 (a, 1H)
1530	[CDCl ₃] 0,95 (dt, 6H); 1,17 (d, 3H); 1,82 (m, 1H); 4,08 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,31 (d, a, 1H); 13,2 (a, 1H)
1532	[CDCl ₃] 0,95 (t, 6H); 1,50 (m, 2H); 1,66 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,21 (d, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1535	[DMSO] 3,32 (s, 6H); 3,45 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 7,33 (d, a, 1H); 8,43 (d, 1H); 8,92 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1537	[DMSO] 3,38 (m, 2H); 3,52 (m, 2H); 4,80 (a, 1H); 7,37 (a, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,96 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1538	[DMSO] 3,25 (s, 3H); 3,49 (m, 4H); 7,37 (d, a, 1H); 8,44 (d, 1H); 8,97 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1545	[DMSO] 1,15 (d, 3H); 3,27 (s, 3H); 3,40 (m, 2H); 4,19 (m, 1H); 7,35 (d, a, 1H); 8,43 (d, 1H); 8,82 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1547	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,25 (s, 3H); 3,40 (m, 4H); 7,38 (a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,94 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1595	[DMSO] 7,45 (d, 1H); 8,15 (a, 1H); 8,40 (a, 1H); 8,50 (d, 1H); 13,7 (a, 1H)
1596	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 7,42 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,80 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1597	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,31 (m, 2H); 7,41 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,85 (a, 1H); 13,45 (a, 1H)
1598	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,54 (m, 2H); 3,25 (c, 2H); 7,41 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,85 (a, 1H); 13,45 (a)
1599	[DMSO] 1,17 (d, 6H); 4,10 (m, 1H); 7,40 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,67 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1600	[DMSO] 0,57 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,86 (m, 1H); 7,41 (d, 1H); 8,37 (d, 1H); 8,80 (a, 1H); 13,35 (a, 1H)
1601	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,60 (m, 2H); 3,45 (c, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,28 (a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1602	[CDCl ₃] 1,78 (m, 2H); 1,95 (m, 2H); 2,40 (m, 2H); 4,57 (m, 1H); 6,86 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,45 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
1603	[CDCl ₃] 1,45 (s, 9H); 6,85 (d, 1H); 8,67 (d, 1H); 9,15 (a, 1H); 12,6 (a, 1H)
1604	[CDCl ₃] 3,05 (s, 6H); 7,07 (d, 1H); 7,80 (d, 1H)
1609	[CDCl ₃] 1,22 (t, 6H); 3,40 (m, 4H); 7,02 (d, 1H); 7,72 (d, 1H)
1617	[DMSO] 0,25 (m, 2H), 0,46 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,22 (m, 2H); 7,45 (d, a, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,95 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1619	[DMSO] 0,90 (s, 9H), 3,15 (d, 2H); 7,38 (d, a, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,80 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1625	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,82 (m, 1H); 3,14 (t, 2H); 7,39 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,91 (t, a, 1H)
1627	[CDCl ₃] 0,92 (d, 6H); 1,49 (m, 2H); 1,68 (m, 1H); 3,46 (m, 2H); 6,87 (d, 1H); 8,70 (d, 1H); 9,22 (a, 1H); 12,8 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1633	[CDCl ₃] 1,78 (s, 3H); 4,02 (d, 2H); 4,88 (d, 2H); 6,87 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,42 (a, 1H); 12,7 (a, 1H)
1634	[CDCl ₃] 2,23 (m, 1H); 4,23 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,73 (d, 1H); 9,51 (a, 1H), 12,8 (a, 1H)
1636	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,51 (m, 2H); 3,95 (m, 1H); 7,41 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,60 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
1638	[DMSO] 0,87 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,32 (m, 2H); 1,46 (m, 2H); 4,03 (m, 1H); 7,40 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,51 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1639	[CDCl ₃] 0,88 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,32 (m, 6H); 1,50 (m, 2H); 4,18 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,12 (d, a, 1H), 12,9 (a, 1H)
1642	[CDCl ₃] 0,92 (t, 6H); 1,20 (d, 3H); 1,32 (m, 1H); 1,46 (m, 1H); 1,67 (m, 1H); 4,27 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,12 (d, a, 1H), 12,9 (a, 1H)
1643	[CDCl ₃] 0,93 (s, 9H); 1,15 (d, 3H); 4,12 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,22 (d, a, 1H)
1644	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,78 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 6,88 (d, 1H); 8,72 (d, 1H); 9,18 (d, a, 1H); 12,7 (a, 1H)
1646	[DMSO] 0,87 (t, 6H); 1,45 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,81 (m, 1H); 7,40 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,52 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1649	[CDCl ₃] 3,40 (s, 6H); 3,61 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 6,87 (d, 1H); 8,69 (d, 1H); 9,32 (a, 1H); 12,3 (a, 1H)
1651	[CDCl ₃] 3,63 (m, 2H); 3,84 (m, 2H); 6,88 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,60 (a, 1H)
1652	[DMSO] 3,25 (s, 3H); 3,50 (m, 4H); 7,40 (d, a, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,92 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1659	[DMSO] 1,15 (d, 3H); 3,25 (s, 3H); 3,38 (m, 2H); 4,17 (m, 1H); 7,40 (d, a, 1H); 8,43 (d, 1H); 8,75 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1661	[DMSO] 1,74 (m, 2H); 3,22 (s, 3H); 3,37 (m, 4H); 7,42 (d, a, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,90 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1666	[CDCl ₃] 3,77 (s, 3H); 4,23 (d, 2H); 6,87 (d, 1H); 8,67 (d, 1H); 9,65 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1711	[DMSO] 2,83 (d, 3H); 8,39 (s, 1H); 8,72 (d, a, 1H); 13,5 (a)
1712	[DMSO] 1,11 (t, 3H); 3,30 (m, 2H); 8,40 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H)
1713	[CDCl ₃] 0,99 (t, 3H); 1,62 (m, 2H); 3,41 (c, 2H); 8,56 (s, 1H); 9,00 (a, 1H)
1714	[CDCl ₃] 1,24 (d, 6H); 4,22 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 9,17 (a, 1H)
1715	[CDCl ₃] 0,61 (m, 2H); 0,90 (m, 2H); 2,95 (m, 1H); 8,57 (s, 1H); 9,02 (a, 1H)
1716	[CDCl ₃] 0,94 (t, 3H); 1,41 (m, 2H); 1,58 (m, 2H); 3,45 (m, 2H); 8,54 (s, 1H); 9,05 (a, 1H)
1717	[CDCl ₃] 1,80 (m, 2H); 1,98 (m, 2H); 2,42 (m, 2H); 4,55 (m, 1H); 8,55 (s, 1H); 9,01 (a, 1H); 12,0 (a, 1H)
1719	[DMSO] 2,83 (s, 3H); 2,97 (s, 3H); 8,04 (s, 1H); 12,6 (a, 1H)
1720	[DMSO] 1,03 (t, 3H); 1,15 (t, 3H); 3,12 (c, 2H); 3,45 (c, 2H); 8,05 (s, 1H); 12,5 (a, 1H)
1721	[CDCl ₃] 0,25 (m, 2H); 0,55 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,32 (m, 2H); 8,57 (s, 1H); 8,93 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1722	[CDCl ₃] 0,96 (s, 9H); 3,28 (d, 2H); 8,59 (s, 1H); 9,05 (a, 1H)
1723	[CDCl ₃] 0,95 (d, 6H); 1,90 (m, 1H); 3,29 (t, 2H); 8,59 (s, 1H); 9,00 (a, 1H); 12,0 (a, 1H)
1725	[CDCl ₃] 0,94 (d, 6H); 1,49 (c, 2H); 1,65 (m, 1H); 3,45 (m, 2H); 8,59 (s, 1H); 8,93 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1727	[CDCl ₃] 4,08 (m, 2H); 5,21 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 8,60 (s, 1H); 9,05 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1728	[CDCl ₃] 1,78 (s, 3H); 4,01 (d, 2H); 4,90 (d, 2H); 8,61 (s, 1H); 9,09 (a, 1H); 11,9 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1731	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,23 (d, 3H); 1,58 (m, 2H); 4,11 (m, 1H); 8,55 (s, 1H); 8,60 (a, 1H)
1733	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,23 (d, 3H); 1,39 (m, 2H); 1,52 (m, 2H); 4,20 (m, 1H); 8,55 (s, 1H); 8,66 (a, 1H)
1734	[CDCl ₃] 0,87 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,35 (m, 6H); 1,52 (m, 2H); 4,17 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,61 (a, 1H)
1735	[CDCl ₃] 0,94 (m, 6H); 1,23 (d, 3H); 1,33 (m, 1H); 1,45 (m, 1H); 1,65 (m, 1H); 4,27 (m, 1H); 8,56 (s, 1H); 8,63 (a, 1H); 11,9 (a)
1736	[CDCl ₃] 0,96 (s, 9H); 1,17 (d, 3H); 4,08 (m, 1H); 8,57 (s, 1H); 8,80 (d, a, 1H)
1737	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,18 (d, 3H); 1,80 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 8,57 (s, 1H); 8,73 (d, a, 1H)
1738	[DMSO] 0,87 (t, 6H); 1,45 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,80 (m, 1H); 8,40 (s, 1H); 8,42 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1739	[CDCl ₃] 3,42 (s, 6H); 3,63 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,49 (s, 1H); 8,74 (a, 1H); 11,4 (a, 1H)
1741	[CDCl ₃] 3,65 (m, 2H); 3,85 (m, 2H); 8,55 (s, 1H); 9,16 (a, 1H)
1742	[CDCl ₃] 3,40 (s, 3H); 3,57 (m, 2H); 3,67 (m, 2H); 8,47 (s, 1H); 8,75 (a, 1H); 11,5 (a, 1H)
1744	[CDCl ₃] 1,27 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,37 (m, 1H); 8,45 (s, 1H); 8,57 (a, 1H); 11,6 (a, 1H)
1745	[CDCl ₃] 1,90 (m, 2H); 3,40 (s, 3H); 3,56 (m, 4H); 8,27 (s, 1H); 8,65 (a, 1H); 11,8 (a, 1H)
1746	[DMSO] 3,67 (s, 3H); 4,13 (d, 2H); 8,38 (s, 1H); 9,12 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
1751	[DMSO] 8,24 (a, 1H); 8,38 (a, 1H); 8,61 (a, 1H); 13,7 (a, 1H)
1752	[CDCl ₃] 3,00 (d, 3H); 8,71 (s, 1H); 8,91 (a, 1H); 12,2 (a, 1H)
1753	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 3,49 (m, 2H); 8,71 (s, 1H); 8,89 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1754	[CDCl ₃] 0,98 (t, 3H); 1,62 (m, 2H); 3,40 (c, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,90 (a, 1H)
1755	[CDCl ₃] 1,25 (d, 6H); 4,25 (m, 1H); 8,68 (a, 2H); 12,0 (a, 1H)
1756	[CDCl ₃] 0,61 (m, 2H); 0,89 (m, 2H); 2,95 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,97 (a, 1H)
1757	[CDCl ₃] 0,94 (t, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,58 (m, 2H); 3,45 (m, 2H); 8,69 (s, 1H); 8,88 (a, 1H); 12,0 (a, 1H)
1758	[CDCl ₃] 1,80 (m, 2H); 1,98 (m, 2H); 2,41 (m, 2H); 4,55 (m, 1H); 8,67 (s, 1H); 8,98 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1759	[CDCl ₃] 1,32 (s, 9H); 8,50 (a, 1H); 8,60 (s, 1H)
1760	[CDCl ₃] 3,12 (s, 6H); 7,99 (s, 1H)
1761	[CDCl ₃] 1,24 (t, 6H); 3,43 (m, 4H); 7,89 (s, 1H)
1762	[CDCl ₃] 0,28 (m, 2H); 0,55 (m, 2H); 1,03 (m, 1H); 3,31 (m, 2H); 8,67 (s, 1H); 8,85 (a, 1H); 11,9 (a, 1H)
1763	[CDCl ₃] 0,96 (s, 9H); 3,27 (d, 2H); 8,71 (s, 1H); 9,00 (a, 1H)
1764	[CDCl ₃] 0,95 (d, 6H); 1,89 (m, 1H); 3,28 (t, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,97 (a, 1H)
1766	[CDCl ₃] 0,95 (d, 6H); 1,48 (c, 2H); 1,65 (m, 1H); 3,45 (m, 2H); 8,69 (s, 1H); 8,85 (a, 1H); 12,0 (a, 1H)
1768	[CDCl ₃] 4,08 (m, 2H); 5,21 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,71 (s, 1H); 9,02 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1769	[CDCl ₃] 1,77 (s, 3H); 4,01 (d, 2H); 4,87 (d, 2H); 8,71 (s, 1H); 9,03 (a, 1H)
1770	[CDCl ₃] 2,23 (m, 1H); 4,23 (m, 2H); 8,72 (s, 1H); 9,20 (a, 1H); 12,0 (a, 1H)
1772	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,55 (m, 2H); 4,10 (m, 1H); 8,67 (a, 1H); 8,70 (s, 1H); 12,1 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1775	[CDCl ₃] 0,89 (t, 3H); 1,21 (d, 3H); 1,33 (m, 6H); 1,51 (m, 2H); 4,17 (m, 1H); 8,60 (a, 1H); 8,68 (s, 1H)
1776	[CDCl ₃] 0,90 (m, 6H); 1,21 (d, 3H); 1,31 (m, 1H); 1,45 (m, 1H); 1,64 (m, 1H); 4,25 (m, 1H); 8,60 (a, 1H); 8,69 (s, 1H)
1777	[CDCl ₃] 0,94 (s, 9H); 1,15 (d, 3H); 4,08 (m, 1H); 8,69 (s, 1H); 8,79 (a, 1H)
1778	[CDCl ₃] 0,93 (m, 6H); 1,17 (d, 3H); 1,79 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 8,67 (s, 1H); 8,71 (a, 1H)
1780	[CDCl ₃] 0,92 (t, 6H); 1,48 (m, 2H); 1,62 (m, 2H); 3,96 (m, 1H); 8,61 (s, 1H); 9,16 (d, a, 1H)
1781	[CDCl ₃] 3,40 (s, 6H); 3,61 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,63 (s, 1H); 8,76 (a, 1H)
1783	[CDCl ₃] 3,64 (m, 2H); 3,86 (m, 2H); 8,68 (s, 1H); 9,17 (a, 1H)
1784	[CDCl ₃] 3,49 (s, 3H); 3,55 (m, 2H); 3,66 (m, 2H); 8,62 (s, 1H); 8,77 (a, 1H)
1785	[CDCl ₃] 1,27 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,44 (m, 2H); 4,37 (m, 1H); 8,56 (a, 1H); 8,60 (s, 1H); 11,9 (a, 1H)
1786	[CDCl ₃] 1,90 (m, 2H); 3,40 (s, 3H); 3,58 (m, 4H); 8,40 (s, 1H); 8,65 (a, 1H)
1787	[CDCl ₃] 3,78 (s, 3H); 4,24 (d, 2H); 8,69 (s, 1H); 9,25 (a, 1H); 11,5 (a, 1H)
1792	[DMSO] 8,22 (a, 1H); 8,37 (a, 1H); 8,81 (a, 1H); 13,7 (a, 1H)
1793	[CDCl ₃] 3,00 (d, 3H); 8,80 (s, a, 2H); 12,0 (a, 1H)
1794	[CDCl ₃] 1,24 (t, 3H); 3,49 (m, 2H); 8,40 (s, a, 2H); 12,0 (a, 1H)
1795	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,53 (m, 2H); 3,26 (c, 2H); 8,72 (s, 1H); 8,78 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1796	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,08 (m, 1H); 8,60 (d, a, 2H); 13,4 (a, 1H)
1797	[DMSO] 0,60 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,88 (m, 1H); 8,68 (s, 1H); 8,77 (d, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1798	[CDCl ₃] 0,94 (t, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,59 (m, 2H); 3,44 (m, 2H); 8,79 (s, a, 2H)
1799	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,27 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 8,71 (s, 1H); 8,95 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1800	[CDCl ₃] 1,43 (s, 9H); 8,70 (a, 1H); 8,85 (s, 1H); 11,5 (a)
1801	[CDCl ₃] 3,10 (s, 6H); 8,20 (s, 1H)
1802	[CDCl ₃] 1,23 (t, 6H); 3,43 (m, a, 4H); 8,12 (s, 1H)
1803	[DMSO] 0,26 (m, 2H); 0,50 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,19 (t, 2H); 8,76 (s, 1H); 8,87 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1804	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 3,13 (d, 2H); 8,61 (t, a, 1H); 8,68 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1805	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,84 (m, 1H); 3,14 (t, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1807	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,40 (c, 2H); 1,62 (m, 1H); 3,30 (m, 2H); 8,71 (s, 1H); 8,73 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1809	[DMSO] 3,93 (m, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 8,71 (s, 1H); 8,89 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1810	[DMSO] 1,72 (s, 3H); 3,87 (d, 2H); 4,85 (d, 2H); 8,71 (s, 1H); 8,87 (t, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1811	[DMSO] 3,18 (m, 1H); 4,10 (m, 2H); 8,69 (s, 1H); 9,01 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1813	[DMSO] 0,87 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,50 (m, 2H); 3,90 (m, 1H); 8,52 (d, a, 1H); 8,72 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1815	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,30 (m, 2H); 1,47 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 8,54 (a, 1H); 8,72 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1817	[CDCl ₃] 0,91 (m, 6H); 1,20 (d, 3H); 1,32 (m, 1H); 1,45 (m, 1H); 1,65 (m, 1H); 4,25 (m, 1H); 8,66 (a, 1H); 8,90 (s, 1H); 11,9 (a, 1H)
1818	[CDCl ₃] 0,94 (s, 9H); 1,14 (d, 3H); 4,07 (m, 1H); 8,85 (a, 1H); 8,90 (s, 1H)
1819	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,18 (d, 3H); 1,79 (m, 1H); 4,04 (m, 1H); 8,75 (a, 1H); 8,89 (s, 1H)
1820	[CDCl ₃] 0,93 (t, 6H); 1,48 (m, 2H); 1,64 (m, 2H); 3,98 (m, 1H); 8,63 (a, 1H); 8,90 (s, 1H); 11,6 (a, 1H)
1821	[CDCl ₃] 3,40 (s, 6H); 3,60 (t, 2H); 4,49 (t, 1H); 8,85 (s, a, 2H); 11,4 (a, 1H)
1823	[CDCl ₃] 3,63 (m, 2H); 3,83 (m, 2H); 8,86 (s, 1H); 9,17 (a, 1H)
1824	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,55 (m, 2H); 3,65 (m, 2H); 8,82 (s, 1H); 8,84 (a, 1H); 11,4 (a, 1H)
1826	[CDCl ₃] 1,25 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,43 (m, 2H); 4,38 (m, 1H); 8,67 (a, 1H); 8,82 (s, 1H); 11,5 (a, 1H)
1827	[CDCl ₃] 1,89 (m, 2H); 3,40 (s, 3H); 3,55 (m, 4H); 8,67 (s, 1H); 8,74 (a, 1H); 11,8 (a, 1H)
1828	[CDCl ₃] 3,78 (s, 3H); 4,24 (d, 2H); 8,89 (s, 1H); 9,30 (a, 1H)
1833	[DMSO] 2,85 (d, 3H); 8,69 (s, 1H); 8,71 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1834	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,30 (m, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1835	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,25 (c, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1837	[DMSO] 0,59 (m, 2H); 0,76 (m, 2H); 2,86 (m, 1H); 8,66 (s, 1H); 8,76 (a, 1H); 13,3 (a)
1838	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,42 (m, 2H); 1,60 (m, 2H); 3,45 (m, 2H); 8,86 (s, 1H); 8,95 (a, 1H)
1839	[CDCl ₃] 1,81 (m, 2H); 2,00 (m, 2H); 2,42 (m, 2H); 4,54 (m, 1H); 8,84 (s, 1H); 9,17 (d, a, 1H); 12,2 (a, 1H)
1845	[CDCl ₃] 0,29 (m, 2H); 0,57 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,32 (t, 2H); 8,87 (s, 1H); 9,05 (a, 1H); 12,3 (a, 1H)
1847	[CDCl ₃] 1,00 (d, 6H); 1,90 (m, 1H); 3,30 (t, 2H); 8,85 (s, 1H); 9,00 (a, 1H)
1849	[CDCl ₃] 0,95 (d, 6H); 1,51 (c, 2H); 1,68 (m, 1H); 3,46 (m, 2H); 8,85 (s, 1H); 8,91 (a, 1H)
1851	[DMSO] 3,94 (m, 2H); 5,16 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1852	[CDCl ₃] 1,79 (s, 3H); 4,02 (m, 2H); 4,92 (m, 2H); 8,88 (s, 1H); 9,10 (t, a, 1H)
1853	[CDCl ₃] 2,26 (m, 1H); 4,22 (m, 2H); 8,86 (s, 1H); 9,25 (a, 1H)
1854	[DMSO] 0,87 (t, 3H); 1,13 (d, 3H); 1,50 (m, 2H); 3,91 (m, 1H); 8,55 (d, a, 1H); 8,70 (a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1856	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,30 (m, 2H); 1,49 (m, 2H); 4,01 (m, 1H); 8,51 (d, a, 1H); 8,71 (s, 1H); 13,6 (a, 1H)
1857	[CDCl ₃] 0,87 (t, 3H); 1,22 (d, 3H); 1,25-1,35 (m, 6H); 1,53 (m, 2H); 4,14 (m, 1H); 8,81 (d, a, 1H); 8,88 (s, 1H)
1858	[CDCl ₃] 0,92 (m, 6H); 1,22 (d, 3H); 1,33 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,65 (m, 1H); 4,25 (m, 1H); 8,84 (a, 1H); 8,88 (s, 1H); 12,3 (a, 1H)
1860	[CDCl ₃] 0,95 (m, 6H); 1,18 (d, 3H); 1,81 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 8,90 (s, 1H); 9,01 (d, a, 1H)
1861	[DMSO] 0,88 (t, 6H); 1,45 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,79 (m, 1H); 8,40 (d, a, 1H); 8,70 (s, 1H); 13,5 (a, 1H)
1867	[DMSO] 3,29 (s, 3H); 3,47 (m, 4H); 8,73 (s, 1H); 8,79 (a, 1H); 13,6 (a, 1H)
1869	[CDCl ₃] 1,28 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (m, 2H); 4,35 (m, 1H); 8,81 (s, 1H); 8,86 (a, 1H); 12,0 (a, 1H)
1870	[CDCl ₃] 1,90 (m, 2H); 3,41 (s, 3H); 3,56 (m, 4H); 8,62 (s, 1H); 8,76 (a, 1H); 11,9 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1877	[DMSO] 2,83 (d, 3H); 8,70 (a, 2H); 13,5 (a, 1H)
1878	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,32 (m, 2H); 8,71 (s, 1H); 8,76 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1879	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,51 (m, 2H); 3,25 (c, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,78 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1880	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,07 (m, 2H); 8,57 (d, a, 1H); 8,72 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1881	[DMSO] 0,58 (m, 2H); 0,74 (m, 2H); 2,85 (m, 1H); 8,66 (s, 1H); 8,74 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1882	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,31 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 3,30 (m, 2H); 8,70 (s, 1H); 8,75 (a, 1H)
1883	[DMSO] 1,69 (m, 2H); 2,02 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,95 (a, 1H)
1884	[CDCl ₃] 1,47 (s, 9H); 8,87 (s, 1H); 9,02 (a, 1H); 12,2 (a, 1H)
1885	[CDCl ₃] 3,12 (s, 6H); 8,16 (s, 1H)
1886	[DMSO] 0,23 (m, 2H); 0,45 (m, 2H); 1,02 (m, 1H); 3,19 (t, 2H); 8,72 (s, 1H); 8,83 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1887	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 3,14 (d, 2H); 8,72 (a, 1H); 8,67 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1888	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,84 (m, 1H); 3,12 (t, 2H); 8,68 (s, 1H); 8,73 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1890	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,41 (m, 2H); 1,60 (m, 1H); 3,30 (m, 2H); 8,69 (s, 1H); 8,72 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1892	[DMSO] 3,94 (m, 2H); 5,15 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,70 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H)
1894	[DMSO] 1,70 (s, 3H); 3,86 (d, 2H); 4,84 (d, 2H); 8,68 (s, 1H); 8,95 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1895	[DMSO] 3,10 (t, 1H); 4,05 (m, 2H); 8,25 (a, 1H); 8,30 (s, 1H); 11,5 (a, 1H)
1897	[CDCl ₃] 0,95 (t, 3H); 1,24 (d, 3H); 1,60 (m, 2H); 4,10 (m, 1H); 8,87 (a, 2H)
1899	[CDCl ₃] 0,92 (t, 3H); 1,23 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,52 (m, 2H); 4,17 (m, 1H); 8,88 (s, 1H); 8,91 (a, 1H)
1900	[DMSO] 0,86 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,25 (m, 6H); 1,48 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 8,53 (d, a, 1H); 8,71 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1903	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,13 (d, 3H); 1,27 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,62 (m, 1H); 4,09 (m, 1H); 8,50 (d, a, 1H); 8,71 (s, 1H); 13,5 (a, 1H)
1904	[DMSO] 0,81 (s, 9H); 1,07 (d, 3H); 3,90 (m, 1H); 8,43 (d, a, 1H); 8,67 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1905	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,10 (d, 3H); 1,75 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 3,85 (m, 1H); 8,49 (d, a, 1H); 8,70 (s, 1H); 13,5 (a, 1H)
1907	[DMSO] 0,87 (t, 6H); 1,43 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,78 (m, 1H); 8,55 (a, 1H); 8,67 (s, 1H); 13,5 (a, 1H)
1910	[CDCl ₃] 3,41 (s, 6H); 3,62 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,82 (s, 1H); 8,95 (a, 1H); 11,2 (a, 1H)
1912	[DMSO] 3,39 (m, 2H); 3,52 (m, 2H); 4,83 (a, 1H); 8,76 (s, 1H); 8,80 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
1913	[DMSO] 3,26 (s, 3H); 3,47 (m, 4H); 8,71 (s, 1H); 8,79 (a, 1H)
1916	[CDCl ₃] 1,27 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,44 (m, 2H); 4,38 (m, 1H); 8,83 (s, 1H); 8,95 (a, 1H); 12,1 (a, 1H)
1917	[DMSO] 1,75 (m, 2H); 3,24 (s, 3H); 3,39 (m, 4H); 8,70 (s, 1H); 8,81 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1918	[DMSO] 3,66 (s, 3H); 4,12 (d, 2H); 8,71 (s, 1H); 9,02 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1923	[DMSO] 2,81 (d, 3H); 8,72 (s, 1H); 8,77 (a, 1H); 13,4 (a)
1924	[DMSO] 1,14 (t, 3H); 3,35 (m, 2H); 8,74 (s, 1H); 8,82 (t, a, 1H); 13,4 (a)
1925	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,53 (m, 2H); 3,28 (c, 2H); 8,73 (s, 1H); 8,80 (t, a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1927	[DMSO] 0,60 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,87 (m, 1H); 8,69 (s, 1H); 8,80 (a, 1H)
1928	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,34 (m, 2H); 1,51 (m, 2H); 3,30 (m, 2H); 8,72 (s, 1H); 8,79 (a, 1H)
1929	[DMSO] 1,72 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,27 (m, 2H); 4,38 (m, 1H); 8,73 (s, 1H); 9,00 (d, a, 1H); 13,3 (a)
1930	[DMSO] 1,37 (s, 9H); 8,30 (a, 1H); 8,66 (s, 1H); 13,4 (a)
1931	[DMSO] 2,80 (s, 3H); 2,96 (s, 3H); 8,27 (s, 1H); 12,4 (a, 1H)
1932	[DMSO] 1,01 (t, 3H); 1,11 (t, 3H); 3,10 (c, 2H); 3,42 (c, 2H); 8,25 (s, 1H); 12,3 (a, 1H)
1933	[DMSO] 0,26 (m, 2H); 0,47 (m, 2H); 1,04 (m, 1H); 3,20 (m, 2H); 8,77 (s, 1H); 8,87 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1934	[DMSO] 0,90 (s, 9H); 3,13 (d, 2H); 8,62 (t, a, 1H); 8,70 (s, 1H); 13,3 (a, 1H)
1935	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,85 (m, 1H); 3,13 (m, 2H); 8,71 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
1937	[CDCl ₃] 0,94 (d, 6H); 1,49 (c, 2H); 1,66 (m, 1H); 3,46 (m, 2H); 8,75 (a, 1H); 8,85 (s, 1H); 11,5 (a)
1939	[DMSO] 3,93 (m, 2H); 5,19 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,72 (s, 1H); 8,90 (t, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1941	[DMSO] 1,72 (s, 3H); 3,87 (d, 2H); 4,87 (d, 2H); 8,73 (s, 1H); 8,89 (t, a, 1H); 13,3 (a)
1942	[DMSO] 3,18 (m, 1H); 4,10 (m, 2H); 8,70 (s, 1H); 9,04 (t, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
1944	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,14 (d, 3H); 1,51 (m, 2H); 3,91 (m, 1H); 8,55 (d, a, 1H); 8,75 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1946	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,31 (m, 2H); 1,47 (m, 2H); 4,01 (m, 1H); 8,56 (a, 1H); 8,74 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1947	[DMSO] 0,85 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,20-1,35 (m, 6H); 1,49 (m, 2H); 4,00 (m, 1H); 8,58 (d, a, 1H); 8,74 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
1948	[DMSO]- 0,88 (d, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,27 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,61 (m, 1H); 4,10 (m, 1H); 8,56 (d, a, 1H); 8,74 (s, 1H); 13,5 (a, 1H)
1949	[CDCl ₃] 0,94 (s, 9H); 1,15 (d, 3H); 4,09 (m, 1H); 8,89 (a, 1H); 8,91 (s, 1H)
1950	[CDCl ₃] 0,94 (m, 6H); 1,17 (d, 3H); 1,80 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 8,88 (a, 1H); 8,92 (s, 1H)
1951	[CDCl ₃] 0,92 (t, 6H); 1,49 (m, 2H); 1,65 (m, 2H); 3,99 (m, 1H); 8,78 (a, 1H); 8,92 (s, 1H)
1952	[CDCl ₃] 3,41 (s, 6H); 3,61 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,84 (s, a, 2H); 11,4 (a, 1H)
1954	[DMSO] 3,39 (m, 2H); 3,52 (m, 2H); 4,80 (a, 1H); 8,79 (s, 1H); 8,82 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1955	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,55 (m, 2H); 3,66 (m, 2H); 8,78 (s, a, 1H); 8,82 (s, 1H); 11,5 (a)
1957	[CDCl ₃] 1,27 (d, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (m, 2H); 4,38 (m, 1H); 8,75 (a, 1H); 8,84 (s, 1H); 12,3 (a, 1H)
1958	[CDCl ₃] 1,89 (m, 2H); 3,41 (s, 3H); 3,56 (m, 4H); 8,61 (s, 1H); 8,68 (a, 1H); 11,8 (a, 1H)
1959	[DMSO] 3,67 (s, 3H); 4,12 (d, 2H); 8,73 (s, 1H); 9,04 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1964	[DMSO] 8,25 (a, 1H); 8,37 (a, 1H); 8,47 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
1965	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 8,37 (s, 1H); 8,72 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1966	[DMSO] 1,13 (t, 3H); 3,34 (m, 2H); 8,39 (s, 1H); 8,76 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1967	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,53 (m, 2H); 3,26 (c, 2H); 8,39 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1968	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,09 (m, 1H); 8,41 (s, 1H); 8,58 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
1969	[DMSO] 0,59 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,86 (m, 1H); 8,34 (s, 1H); 8,73 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
1971	[DMSO] 1,70 (m, 2H); 2,04 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,38 (m, 1H); 8,39 (s, 1H); 8,92 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2006	[DMSO] 8,25 (a, 1H); 8,35 (a, 1H); 8,61 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
2007	[DMSO] 2,82 (d, 3H); 8,51 (s, 1H); 8,74 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2008	[DMSO] 1,13 (t, 3H); 3,33 (m, 2H); 8,53 (s, 1H); 8,78 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2009	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,53 (m, 2H); 3,26 (c, 2H); 8,51 (s, 1H); 8,76 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2010	[DMSO] 1,18 (d, 6H); 4,07 (m, 1H); 8,53 (s, 1H); 8,61 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2011	[DMSO] 0,58 (m, 2H); 0,74 (m, 2H); 2,86 (m, 1H); 8,48 (s, 1H); 8,77 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2012	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,33 (m, 2H); 1,51 (m, 2H); 3,30 (m, 2H); 8,52 (s, 1H); 8,77 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2013	[DMSO] 1,72 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 8,51 (s, 1H); 8,95 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2014	[DMSO] 1,37 (s, 9H); 8,31 (a, 1H); 8,45 (s, 1H); 13,4 (a, 1H)
2015	[DMSO] 2,82 (s, 3H); 2,95 (s, 3H); 8,12 (s, 1H); 12,5 (a, 1H)
2017	[DMSO] 0,26 (m, 2H); 0,47 (m, 2H); 1,04 (m, 1H); 3,30 (m, 2H); 8,56 (s, 1H); 8,86 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2018	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 3,13 (d, 2H); 8,47 (s, 1H); 8,63 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2019	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,83 (m, 1H); 3,13 (m, 2H); 8,50 (s, 1H); 8,73 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2021	[DMSO] 0,89 (d, 6H); 1,42 (c, 2H); 1,62 (m, 1H); 3,31 (m, 2H); 8,51 (s, 1H); 8,75 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2023	[DMSO] 3,94 (m, 2H); 5,18 (dd, 2H); 5,89 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,88 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2025	[DMSO] 1,72 (s, 3H); 3,86 (d, 2H); 4,85 (d, 2H); 8,50 (s, 1H); 8,87 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2026	[DMSO] 3,18 (m, 1H); 4,10 (m, 2H); 8,48 (s, 1H); 9,02 (t, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2030	[CDCl ₃] 0,93 (t, 3H); 1,23 (d, 3H); 1,40 (m, 2H); 1,52 (m, 2H); 4,21 (m, 1H); 8,74 (s, 1H); 8,97 (d, a, 1H); 12,9 (a, 1H)
2031	[DMSO] 0,85 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,20-1,35 (m, 6H); 1,48 (m, 2H); 3,99 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,54 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2032	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,14 (d, 3H); 1,27 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,62 (m, 1H); 4,10 (m, 1H); 8,51 (s, 1H); 8,53 (d, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2035	[DMSO] 0,86 (t, 6H); 1,45 (m, 2H); 1,55 (m, 2H); 3,78 (m, 1H); 8,82 (d, a, 1H); 8,51 (s, 1H); 13,5 (a, 1H)
2036	[CDCl ₃] 3,41 (s, 6H); 3,61 (t, 2H); 4,50 (t, 1H); 8,67 (s, 1H); 9,00 (a, 1H); 11,7 (a, 1H)
2038	[DMSO] 3,35 (m, 2H); 3,53 (m, 2H); 4,81 (a, 1H); 8,56 (s, 1H); 8,80 (t, a, 1H); 13,6 (a, 1H)
2039	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,56 (m, 2H); 3,65 (m, 2H); 8,65 (s, 1H); 9,01 (s, 1H); 11,8 (a, 1H)
2041	[DMSO] 1,15 (d, 3H); 3,30 (s, 3H); 3,40 (m, 2H); 4,18 (m, 1H); 8,52 (s, 1H); 8,64 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2048	[DMSO] 8,20 (a, 1H); 8,37 (a, 1H); 8,81 (s, 1H); 13,7 (a, 1H)
2090	[DMSO] 7,45(d, 1H); 8,14(a, 1H); 8,42 (a, 1H); 8,48 (d, 1H); 13,7 (a, 1H)
2091	[DMSO] 2,84 (d, 3H); 7,42 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,79 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2092	[DMSO] 1,12 (t, 3H); 3,32 (m, 2H); 7,42 (d, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,83 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2093	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,54 (m, 2H); 3,27 (c, 2H); 7,42 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,82 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)

ES 2 539 517 T3

(continuación)

Ej. N°	Datos de RMN de 1H
2095	[CDCl ₃] 0,61 (m, 2H); 0,88 (m, 2H); 3,00 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 8,68 (d, 1H); 9,35 (a, 1H); 12,5 (a, 1H)
2096	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,33 (m, 2H); 1,52 (m, 2H); 3,32 (m, 2H); 7,42 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,81 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2097	[DMSO] 1,72 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,46 (m, 2H); 4,41 (m, 1H); 7,43 (d, 1H); 8,39 (d, 1H); 8,96 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2101	[DMSO] 0,26 (m, 2H), 0,47 (m, 2H); 1,06 (m, 1H); 3,22 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,91 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2102	[DMSO] 0,92 (s, 9H); 3,15 (d, 2H); 7,40 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,75 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2103	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,83 (m, 1H); 3,14 (t, 2H); 7,40 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,81 (t, a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2105	[DMSO] 0,90 (d, 6H); 1,42 (m, 2H); 1,62 (m, 1H); 3,33 (m, 2H); 7,41 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 8,80 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2107	[DMSO] 3,95 (t, 2H); 5,17 (dd, 2H); 5,90 (m, 1H); 7,41 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,93 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2109	[DMSO] 1,72 (s, 3H); 3,88 (d, 2H); 4,85 (d, 2H); 7,42 (d, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,94 (a, 1H); 13,3 (a, 1H)
2110	[DMSO] 3,17 (m, 1H); 4,11 (m, 2H); 7,41 (d, 1H); 8,40 (d, 1H); 9,06 (a, 1H), 13,3 (a, 1H)
2112	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,53 (m, 2H); 3,95 (m, 1H); 7,42 (d, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,60 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2114	[DMSO] 0,88 (t, 3H); 1,15 (d, 3H); 1,32 (m, 2H); 1,48 (m, 2H); 4,04 (m, 1H); 7,42 (d, 1H); 8,41 (d, 1H); 8,59 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2115	[DMSO] 0,85 (t, 3H); 1,16 (d, 3H); 1,20-1,35 (m, 6H); 1,50 (m, 2H); 4,02 (m, 1H); 7,42 (d, 1H); 8,44 (d, 1H); 8,62 (d, a, 1H), 13,4 (a, 1H)
2116	[DMSO] 0,88 (d, 6H); 1,14 (d, 3H); 1,25 (m, 1H); 1,48 (m, 1H); 1,63 (m, 1H); 4,21 (m, 1H); 6,92 (d, 1H); 8,42 (d, 1H); 8,59 (d, a, 1H), 13,4 (a, 1H)
2122	[DMSO] 3,40 (m, 2H); 3,52 (m, 2H); 4,82 (a, 1H); 7,44 (d, 1H); 8,46 (d, 1H); 8,88 (a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2133	[DMSO] 2,83 (d, 3H); 8,58 (s, 1H); 8,82 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2134	[DMSO] 1,14 (t, 3H); 3,34 (m, 2H); 8,60 (s, 1H); 8,86 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2135	[DMSO] 0,89 (t, 3H); 1,54 (m, 2H); 3,26 (c, 2H); 8,59 (s, 1H); 8,85 (t, a, 1H); 13,5 (a, 1H)
2137	[DMSO] 0,60 (m, 2H); 0,75 (m, 2H); 2,88 (m, 1H); 8,55 (s, 1H); 8,85 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2138	[DMSO] 0,90 (t, 3H); 1,33 (m, 2H); 1,51 (m, 2H); 3,31 (m, 2H); 8,59 (s, 1H); 8,84 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2139	[DMSO] 1,71 (m, 2H); 2,05 (m, 2H); 2,25 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 8,62 (s, 1H); 9,04 (d, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2143	[DMSO] 0,26 (m, 2H); 0,47 (m, 2H); 1,05 (m, 1H); 3,20 (m, 2H); 8,63 (s, 1H); 8,94 (t, a, 1H); 13,4 (a, 1H)
2144	[DMSO] 0,91 (s, 9H); 3,15 (d, 2H); 8,55 (s, 1H); 8,66 (t, a, 1H); 13,3 (a, 1H)

3. Ejemplos biológicos

3.1 Evaluación del efecto perjudicial

- 5 El efecto perjudicial en las plantas se valora según una escala del 0-100 % visualmente en comparación con plantas de control:

0 % = ningún efecto observable en comparación con la planta no tratada

100% = la planta tratada muere

3.2 Efecto herbicida y efecto protector en la postemergencia

Se siembran semillas o trozos de rizoma de plantas perjudiciales mono- y dicotiledóneas y de plantas de cultivo en macetas de plástico en tierra arcillosa arenosa, se cubren con tierra y se cultivan en el invernadero en buenas condiciones de crecimiento. Como alternativa a esto se cultivan plantas perjudiciales que aparecen en el cultivo de arroz con cáscara en macetas en las que el agua se encuentra hasta 2 cm por encima de la superficie del suelo. Tres semanas después de la siembra se tratan las plantas de ensayo en el estadio de tres hojas. Las combinaciones de principio activo de herbicida-protector de acuerdo con la invención formuladas como concentrados de emulsión así como en ensayos paralelos los principios activos individuales formulados correspondientemente se pulverizan en distintas dosificaciones con una dosis de aplicación de agua de, calculado, 300 l/ha sobre las partes de plantas verdes y después de 2-3 semanas de tiempo de espera de las plantas de ensayo del invernadero en condiciones de crecimiento óptimas se evalúa el efecto de las preparaciones visualmente en comparación con los controles no tratados. En el caso de arroz o en el caso de plantas perjudiciales que aparecen en el cultivo de arroz, los principios activos se ponen también directamente en el agua de riego (aplicación en analogía a la denominada aplicación de granulado) o se pulverizan sobre plantas y en el agua de riego.

Los ensayos muestran que los protectores de acuerdo con la invención en combinación con herbicidas en proporción de herbicida:protector de 2:1 a 1:20 reducen sustancialmente los daños del herbicida en plantas de cultivo tales como maíz, arroz, trigo o cebada u otros cereales o en plantas de cultivo dicotiledóneas tales como soja o colza en comparación con la aplicación de los herbicidas individuales sin protector, de tal manera que se observa del 30 % al 100 % menos daños en la planta de cultivo. Al mismo tiempo, el efecto del herbicida en plantas perjudiciales económicamente importantes no se altera o no sustancialmente, de tal manera que se puede conseguir un efecto de postemergencia herbicida bueno frente a un amplio espectro de malas hierbas y malezas.

Por ejemplo, en la cebada para el herbicida mesosulfurona-metilo con los compuestos N° 1, 2, 3, 5, 7, 9, 10, 13, 14, 22, 25, 26, 30, 34, 36, 40, 57, 64, 66, 79, 100, 101, 102, 105, 114, 115, 116, 117, 119, 123, 124, 128, 130, 134, 136, 138, 140, 146, 148, 153, 154, 155, 157, 163, 165, 168, 169, 171, 178, 193, 194, 214, 341, 342, 344, 345, 346, 382, 384, 392, 398, 405, 407, 455, 457, 489, 496, 498, 571, 909, 910, 911, 913, 943, 950, 960, 1023, 1026, 1029, 1030, 1201, 1481, 1487, 1598, 1599, 1600, 1636, 1907 se pudo conseguir un buen efecto protector.

En el maíz se pudo conseguir, por ejemplo, para el herbicida tembotriona una buena actividad protectora en los siguientes compuestos de la tabla 1: 4, 6, 9, 10, 14, 24, 32, 34, 36, 43, 64, 66, 71, 75, 79, 105, 114, 118, 140, 146, 148, 153, 169, 178, 210, 214, 345, 51, 95, 341, 456, 457, 489, 496, 498, 909, 911, 913, 943, 960, 1026, 1139, 1368, 1371, 1485, 1488, 1596, 1597, 1598, 1599, 1600, 1604, 1619, 1625, 1629, 1636, 1638, 1646, 1758.

En arroz por ejemplo los siguientes compuestos de la tabla 1 consiguieron una buena actividad protectora en fenoxaprop-P-etilo y tiencarbazona o tiencarbazona-metilo:

1, 2, 3, 4, 9, 16, 20, 22, 34, 41, 47, 54, 57, 75, 76, 79, 80, 81, 101, 103, 105, 114, 115, 117, 118, 120, 127, 128, 130, 153, 154, 157, 162, 165, 169, 171, 178, 218, 271, 341, 342, 344, 345, 346, 350, 355, 392, 398, 405, 407, 456, 973, 1482, 1596, 1597, 1598, 1600, 1603, 1609, 1625, 1638, 1646, 1659.

3.3 Efecto herbicida y efecto protector en la preemergencia

Se sembraron semillas o trozos de rizoma de plantas de malas hierbas mono- y dicotiledóneas y plantas de cultivo en macetas de plástico en tierra arcillosa arenosa y se cubrieron con tierra. Las combinaciones de principio activo de herbicida-protector de acuerdo con la invención formuladas como concentrados de suspensión o emulsión así como en ensayos paralelos los principios activos individuales formulados correspondientemente, entonces se administraron en distintas dosificaciones con una dosis de aplicación de agua de recalculado 600 a 800 l/ha sobre la superficie de la tierra de cubierta.

Después del tratamiento se colocaron las macetas en el invernadero y se mantuvieron en buenas condiciones de crecimiento para las malas hierbas y las plantas de cultivo. La evaluación visual de los daños de las plantas o de la emergencia se realizó después de la emergencia de las plantas de ensayo después de un tiempo de ensayo de 3 a 4 semanas en comparación con los controles no tratados. Como mostraron los resultados del ensayo, mediante los compuestos de acuerdo con la invención se evitaron o redujeron los daños por herbicida en las plantas de cultivo sin que se redujese o redujese sustancialmente el efecto herbicida en las plantas perjudiciales.

Por ejemplo, los ejemplos N° 2, 19, 39, 72, 104, 122, 155, 193, 194, 217, 232, 271, 341, 380, 392, 1368, 1597, 1625, 1636 de la tabla 1 en el ensayo en combinación con el herbicida isoxaflutol mostraron un buen efecto protector en maíz. El efecto herbicida de los principios activos herbicidas usados a este respecto no estaba alterado. Por tanto, los protectores son adecuados en combinación con herbicidas en muchos casos para el control selectivo de plantas perjudiciales en el tratamiento de preemergencia de cultivos de plantas útiles.

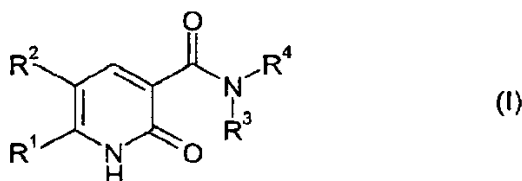
3.4 Tratamiento de la simiente

Se mezclaron granos de simiente de plantas de cultivo con los protectores de acuerdo con la invención formulados como concentrados de suspensión o emulsión y agua en frascos y se agitaron bien de tal manera que los granos de

5 simiente se revistieron uniformemente con la formulación del respectivo protector. Los granos de simiente o las plantas emergidas entonces se sometieron a ensayo en el procedimiento de preemergencia o postemergencia de forma correspondiente a los ensayos según los ejemplos 3.3 o 3.2 con herbicidas. También en el tratamiento de la simiente, los protectores mostraron un buen efecto. A este respecto no estaba alterado el efecto herbicida de los principios activos herbicidas usados.

REIVINDICACIONES

1. Uso de compuestos de fórmula (I) o de sus sales



en la que

5 R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆) y

R² significa hidrógeno o halógeno y

R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₆), alquenilo (C₂-C₁₆) o alquinilo (C₂-C₁₆),

10 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo, que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,

15 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros, o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

20 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,

y

R⁴ significa alquilo (C₁-C₁₆), alquenilo (C₂-C₁₆) o alquinilo (C₂-C₁₆),

25 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,

30 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

35 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,

o

R³ significa alcoxi (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₆) o haloalcoxi (C₂-C₄) y

R⁴ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄)

o

40 R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significan un anillo heterocíclico de cuatro a ocho miembros que, aparte del átomo de N, puede contener también otros heteroátomos de anillo y que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, ciano, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄),

o

R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significan el grupo

-N=CR⁵-NR⁶R⁷, en la que

R⁵ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆) y

R⁶, R⁷ representan independientemente entre sí hidrógeno o alquilo (C₁-C₄) o

5 R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido directamente forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros

o

R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆),

R² significa halógeno,

10 R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno

o

R¹ significa un resto de la fórmula CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F,

15 R² significa hidrógeno,

R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno,

como agentes protectores de plantas útiles para la reducción o la evitación de efectos perjudiciales de productos agroquímicos en las plantas útiles.

20 2. Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque

R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),

estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

25 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄),

fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄), y

30 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,

o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₄-C₆), cicloalquino (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalqueno (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

35 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄),

40 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄), y

heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,

y

- R⁴ significa alquilo (C₁-C₁₀), alquenilo (C₂-C₁₀) o alquinilo (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- 5 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄),
 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄), y
- 10 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,
 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₄-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros, o cicloalquenilo (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
- 15 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄)
- 20 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄), y
 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo.
3. Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque
- 25 R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alquenilo (C₂-C₁₀) o alquinilo (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- 30 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄),
 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄), y
 heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,
- 35 o cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
 estando cada uno de los 2 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄),
- y
- 40 R⁴ significa alquilo (C₁-C₁₀), alquenilo (C₂-C₁₀) o alquinilo (C₂-C₁₀),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
- 45 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄),
 fenilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄), y

heterociclilo que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y oxo,

o cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,

5 estando cada uno de los 2 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo alquilo (C₁-C₄).

4. Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque

R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),

10 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,

y

R⁴ significa alquilo (C₁-C₁₀), alqueno (C₂-C₁₀) o alquino (C₂-C₁₀),

estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄) y [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo.

15 5. Uso de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque

R¹ significa CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F

y

R² significa hidrógeno o halógeno.

6. Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque

20 R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆),

R² significa halógeno,

R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno.

7. Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque

25 R¹ significa un resto de fórmula CF₂Cl, CF₂H, CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F,

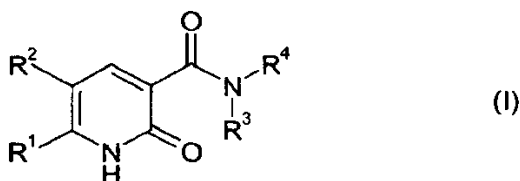
R² significa hidrógeno,

R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno.

30 8. Uso de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque se usan uno o varios compuestos de fórmula (I) o sus sales junto con uno o varios productos agroquímicos que aplicados en solitario causan daños en las plantas útiles dado el caso en presencia de coadyuvantes de formulación.

9. Compuestos de fórmula (I) o sus sales



35 en la que

R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆),

- R² significa hidrógeno o halógeno y
- R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₁₆), alqueno (C₂-C₁₆) o alquino (C₂-C₁₆),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo y [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₄-C₆), cicloalquino (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros, o cicloalqueno (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,
- 15 y
- R⁴ significa alquilo (C₁-C₁₆), alqueno (C₂-C₁₆) o alquino (C₂-C₁₆),
 estando cada uno de los 3 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo y [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 o cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₄-C₆), cicloalquino (C₃-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros o cicloalqueno (C₄-C₆) que está condensado en un lado del anillo con un anillo carbocíclico saturado o insaturado de 4 a 6 miembros,
 estando cada uno de los 4 restos mencionados en último lugar no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di[alquil (C₁-C₄)]-amino, [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, [haloalcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo,
 cicloalquilo (C₃-C₆) que está no sustituido o sustituido, fenilo que está no sustituido o sustituido y heterociclilo que está no sustituido o sustituido,
- o
- 30 R³ significa alcoxi (C₁-C₄), alqueno (C₂-C₄), alquino (C₂-C₆) o haloalcoxi (C₂-C₄) y
 R⁴ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄)
- o
- R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significan un anillo heterocíclico de cuatro a ocho miembros que aparte del átomo de N puede contener también otros heteroátomos de anillo y que está no sustituido o sustituido con uno o varios restos del grupo de halógeno, ciano, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y alquiltio (C₁-C₄),
- o
- R³ y R⁴ junto con el átomo de N unido directamente significan el grupo
 $-N=CR^5-NR^6R^7$, en la que
- 40 R⁵ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆) y
 R⁶, R⁷ representan independientemente entre sí hidrógeno o alquilo (C₁-C₄) o
 R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido directamente forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros
- o
- 45 R¹ significa un resto haloalquilo (C₁-C₆),

R² significa halógeno,

R³ significa hidrógeno y

R⁴ significa hidrógeno

o

5 R¹ significa un resto de la fórmula CF₂CF₃, CF₂CF₂H, CF₂CF₂Cl, CFCICF₃, CFHCF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, CF₂CF₂CF₃ o C(CH₃)₂F,

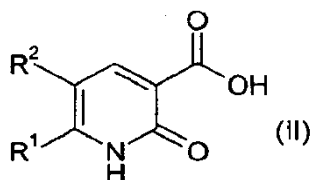
R² significa hidrógeno,

R³ significa hidrógeno y

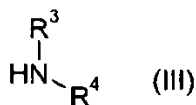
R⁴ significa hidrógeno.

10 10. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula general (I) o de sus sales de acuerdo con la reivindicación 9, caracterizado porque

(a) un ácido carboxílico de fórmula general (II)

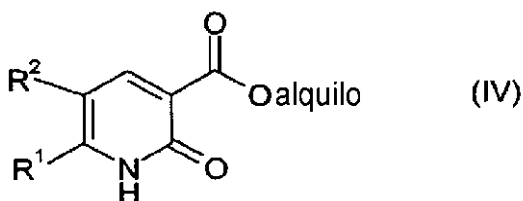


15 en la que R¹ y R² son como se han definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar, se hace reaccionar con una amina de fórmula (III) o su sal

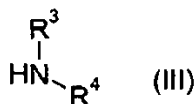


en la que R³ y R⁴ son como se ha definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar hasta dar el compuesto de fórmula (I) o

(b) un éster de ácido carboxílico de fórmula general (IV)

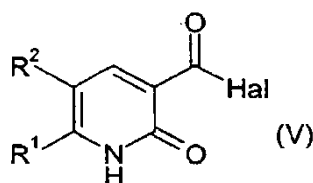


20 en la que R¹ y R² son como se han definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar y "alquilo" significa un resto alquilo, con una amina de fórmula (III) o su sal

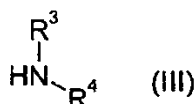


25 en la que R³ y R⁴ son como se ha definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar, se hace reaccionar hasta dar el compuesto de fórmula (I) o

(c) un halogenuro o anhídrido de ácido carboxílico de fórmula general (V)



en la que R¹ y R² son como se ha definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar y Hal significa un átomo de halógeno o un resto aciloxi, se hace reaccionar con una amina de fórmula (III) o su sal



5 en la que R³ y R⁴ son como se ha definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar, hasta dar el compuesto de fórmula (I), o

(d) en el caso de que R³ y R⁴ en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar significan respectivamente hidrógeno

un compuesto de fórmula (VI),



10 en la que R¹ es como se ha definido en el compuesto de fórmula (I) que se debe preparar y "alquilo" significa un resto alquilo,

se hace reaccionar con diamida de ácido malónico hasta dar el compuesto de fórmula (I).

15 11. Agente fitoprotector caracterizado porque contiene uno o varios compuestos de fórmula (I) o sus sales, tal como se ha definido según una de las reivindicaciones 1 a 7 y 9 y coadyuvantes de formulación.

12. Agente fitoprotector caracterizado porque contiene uno o varios compuestos de fórmula (I) o sus sales, tal como se ha definido según una de las reivindicaciones 1 a 7 y 9 y uno o varios productos agroquímicos y dado el caso coadyuvantes de formulación.

20 13. Procedimiento para la protección de plantas útiles frente a efectos secundarios fitotóxicos de productos agroquímicos, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz de uno a varios compuestos de fórmula (I) o de sus sales, tal como se ha definido según una de las reivindicaciones 1 a 7 y 9, antes, después o simultáneamente con el o los productos agroquímicos sobre las plantas, partes de plantas, semillas de plantas o la simiente.

14. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 13, caracterizado porque la aplicación se realiza en el procedimiento de postemergencia.

25 15. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 13, caracterizado porque la aplicación se realiza con el compuesto de fórmula (I) o su sal mediante tratamiento de las semillas de plantas o de la simiente.

16. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 13, caracterizado porque la aplicación se realiza en el procedimiento de preemergencia.

30 17. Procedimiento para combatir selectivamente plantas perjudiciales en cultivos de plantas útiles, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz de uno o varios compuestos de fórmula (I) o de sus sales, tal como se han definido según una de las reivindicaciones 1 a 7 y 9, antes, después o simultáneamente con uno o varios herbicidas sobre las plantas, partes de plantas, semillas de plantas o la simiente.

35 18. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 17, caracterizado porque se trata la simiente con uno o varios compuestos de fórmula (I) o sus sales y se aplica el herbicida después de la siembra en el procedimiento de preemergencia o en el procedimiento de postemergencia.