



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: 2 543 352

(51) Int. CI.:

C07D 401/12 (2006.01) A01N 43/713 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01) A01N 43/84 (2006.01) A01P 3/00 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- (96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 07.08.2008 E 08792310 (8) (97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: 27.05.2015 EP 2177519
- (54) Título: Derivado de tetrazoiloxima y agente de control de enfermedades de las plantas
- (30) Prioridad:

08.08.2007 JP 2007206297

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: 18.08.2015

(73) Titular/es:

NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%) 2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku Tokyo 100-8165, JP

(72) Inventor/es:

KOBORI, TAKEO; **NOMURA, HAZUMI; URIHARA, ICHIROU;** HOSOKAWA, HIROYASU; ISSHIKI, ATSUNORI; ITO, SYUICHI; **INAGAKI, JUN y FUJII, KAZUSHIGE**

(74) Agente/Representante:

CURELL AGUILÁ, Mireia

DESCRIPCIÓN

Derivado de tetrazoiloxima y agente de control de enfermedades de las plantas.

5 Campo técnico

15

20

25

40

45

La presente invención se refiere a un nuevo derivado de tetrazoiloxima como se define en las reivindicaciones, y a un agente de control de enfermedades de las plantas que contiene el mismo como principio activo.

10 Antecedentes de la técnica

En el cultivo de cultivos agrícolas y hortícolas, se ha usado un gran número de agentes de control frente a los daños del cultivo. Sin embargo, muchos de ellos son apenas satisfactorios como agentes de control debido a la eficacia del control insuficiente, restricciones sobre su uso debido a la aparición de hongos patógenos que tienen resistencia a fármacos, fitotoxicidad o contaminación sobre las plantas, o fuerte toxicidad sobre seres humanos, animales domésticos y peces. Por lo tanto, ha resultado necesario desarrollar agentes de control de enfermedades de las plantas aplicables de forma segura y que presenten menos inconvenientes de los mencionados anteriormente.

Con respecto a la presente invención, los documentos 1 a 3 de patente describen derivados de tetrazoiloxima que tiene una estructura similar a la de los compuestos de la presente invención.

[Documento 1 de Patente]

Solicitud de patente Japonesa sin examinar, primera publicación nº 2004-131416, que describe un compuesto tetrazólico que se representa mediante la fórmula (1)

en la que R1 representa un grupo alquilo de C1-3; R2 representa un átomo de halógeno; n representa un número entero de 0-3; y Q representa la fórmula Q1 o Q14 (en la que, R3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo NHCOR5; y R4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-3). Un agente de control para las lesiones por una enfermedad de las plantas comprende el compuesto tetrazólico como principio activo. Una planta o suelo para cultivar la planta se trata con una cantidad eficaz del compuesto tetrazólico.

[Documento 2 de patente]

Solicitud de patente japonesa sin examinar, primera publicación nº 2004-131392, en la que la descripción de este documento es similar a la del documento 1 de patente.

[Documento 3 de patente]

Solicitud de patente japonesa sin examinar, primera publicación nº 2003-137875, que describe un derivado de tetrazoiloxima, que se representa mediante la fórmula general (I)

en la que X es hidrógeno, un átomo de halógeno, grupo alquilo, grupo alcoxi, grupo ciano, grupo metanosulfonilo, grupo nitro, grupo trifluorometilo o arilo; A es un grupo 1-alquiltetrazoil-5-ilo o a 5-alquiltetrazoil-1-ilo; Het es un

piridilo sustituido o un tiazolilo sustituido. También se describe un agente de control de enfermedades de las plantas que contiene el derivado como principio activo.

Descripción de la invención

Problemas que debe resolver por la invención

Sin embargo, incluso los compuestos descritos en estos documentos de patentes no tienen necesariamente un efecto de control suficiente.

En estas circunstancias de técnicas anteriores, se ha obtenido la presente invención, y un objetivo de la misma es proporcionar un derivado de tetrazoiloxima o una sal del mismo, que es

excelente en un efecto de control frente a la lesión por una enfermedad de las plantas, y un agente de control de enfermedades de las plantas que contiene al menos un tipo de ellos como principio activo.

Medios para resolver los problemas

Se ha sintetizado un gran número de derivados de tetrazoiloxima y se ha estudiado exhaustivamente sobre su bioactividad para lograr el efecto anterior, y se ha descubierto que el derivado de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1) representada a continuación y una sal del mismo, como se define en las reivindicaciones, exhibe un excelente efecto de control frente a la lesión por una enfermedad de las plantas, y son aplicables de forma segura sin provocar fitotoxicidad frente a plantas útiles. De este modo, se ha completado la presente invención.

25 Según el primer aspecto de la presente invención, está previstos unos derivados de tetrazoiloxima de [1] representados a continuación, o sus sales.

[1] Un derivado de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1):

O
$$CH_2$$
—Het (1)

30

5

10

15

en la que X representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-8} , un grupo alcoxi de C_{1-8} , un grupo ciano, un grupo alquil C_{1-8} -sulfonilo, un grupo nitro, un grupo haloalquilo de C_{1-8} , o un grupo arilo no sustituido o sustituido:

35

n1 representa uno cualquiera de números enteros de 0 a 5, y cuando n1 es 2 o más, X(s) puede ser igual o diferente entre sí:

A representa un grupo tetrazoílo representado por la fórmula (2):

40

$$N$$
 (2)

(en la que Y representa un grupo alquilo de C₁₋₈), o un grupo tetrazoílo representado por la fórmula (3):

$$N$$
 (3)

(en la que Y es igual a como se define anteriormente); y

Het representa un grupo piridilo representado por la fórmula (4):

$$R_{n2}$$
 (4)

5

(en la que al menos un R representa un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo formilo, un grupo carboxilo, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de $C_{2.8}$ no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de $C_{2.8}$ no sustituido o sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, OR1, $S(O)_mR^1$, COR^1 , o CO_2R^1 ,

15

10

R¹ representa un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C₃₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de C₂₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de C₂₋₈ no sustituido o sustituido, o un grupo arilo no sustituido o sustituido,

m representa uno cualquiera de números enteros de 0 a 2,

20

n2 representa uno cualquiera de números enteros de 1 a 3, y cuando n2 es 2 o más, varios R(s) pueden ser iguales o diferentes entre sí,

Z representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino, o un grupo representado por la fórmula: Q3C(=O)NH- (en

sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de

C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈ tio no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈

25

la que Q3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-8, un grupo haloalquilo de C1-8, un grupo alquenilo de C₂₋₈, un grupo haloalquenilo de C₂₋₈, un grupo alquinilo de C₂₋₈, un grupo haloalquinilo de C₂₋₈, un grupo alcoxi de C₁₋₈, un grupo haloalcoxi de C₁₋₈, un grupo alquenil C₂₋₈-oxi, un grupo haloalquenil C₂₋₈-oxi, un grupo alquinil C₂₋₈-oxi, un grupo haloalquinil C₂₋₈-oxi, un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo cicloalquil C₃₋₈-oxi, un grupo alquil C₁₋₈-amino, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-8-oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C1-8 sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfinilo no sustituido o

35

30

40

45

[2] El derivado de tetrazoiloxima según [1], en el que Y es un grupo metilo, y una sal del mismo.

sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido), y una sal del mismo.

Según un segundo aspecto de la presente invención, se proporciona un agente de control una enfermedad de las plantas que incluye el derivado de tetrazoiloxima según [1] o [2], o una sal del mismo, como principio activo.

Efectos de la invención

50

60

Según la presente invención como se define en las reivindicaciones, se proporciona un derivado de tetrazoiloxima que es excelente en un efecto de control frente a lesión por una enfermedad de las plantas, o una sal de los mismos, y un agente de control de una enfermedad de las plantas que lo contiene como principio activo.

55 Mejor modo de poner en práctica la invención

La presente invención se explicará con detalle al dividirla en los apartados 1) un derivado de tetrazoiloxima y una sal de los mismos, y 2) un agente de control de una enfermedad de las plantas.

1) Derivado de tetrazoiloxima y sal del mismo

El primer aspecto de la presente invención se refiere a un derivado de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1) representada anteriormente, y una sal del mismo.

En la fórmula (1) representada anteriormente, X representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁₋₈, un 5 grupo alcoxi de C₁₋₈, un grupo ciano, un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo, un grupo nitro, un grupo haloalquilo de C₁₋₈, o un grupo arilo no sustituido o sustituido.

Los ejemplos específicos de átomo de halógeno para X incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de yodo.

Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C₁₋₈ incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, y un grupo n-hexilo.

15 Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi, y un grupo n-hexiloxi.

Los ejemplos específicos del grupo alquil C_{1.8}-sulfonilo incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, y un grupo t-butilsulfonilo.

Los ejemplos específicos del grupo haloalquilo de C₁₋₈ incluyen un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 3,3,3,2,2-pentafluoropropilo, y un grupo 2,2,2-trifluoro-1trifluorometiletilo.

Un grupo arilo un grupo arilo no sustituido o sustituido significa un grupo arilo monocíclico o policíclico, y el grupo arilo policíclico incluye, además de un grupo completamente insaturado, un grupo parcialmente insaturado. Específicamente, se ejemplifican un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2-naftilo, un grupo azulenilo, un grupo indanilo, y un grupo tetralinilo, y se prefiere un grupo arilo de C₆₋₁₀.

El sustituyente del grupo arilo del grupo arilo no sustituido o sustituido no está limitado particularmente en tanto que sea químicamente aceptable. Ejemplos específicos del sustituyente incluyen sustituyentes mostrados a continuación:

- (1) átomos de halógeno tales como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de vodo.
- (2) grupos alquilo tales como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo nbutilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, y un grupo n-hexilo,
- (3) grupos cicloalquilo tales como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, y un grupo cicloheptilo,
- (4) grupos alcoxi tales como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, y un grupo t-butoxi,
 - (5) grupos alquenilo tales como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, y un grupo 5-hexenilo,
 - (6) grupos cicloalquenilo tales como un grupo 2-ciclopropenilo, un grupo 2-ciclopentenilo, un grupo 3ciclohexenilo, y un grupo 4-ciclooctenilo,
 - (7) grupos alqueniloxi tales como un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo 1-propeniloxi, un grupo 2-buteniloxi,
 - (8) grupos alquinilo tales como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3pentinilo, un grupo 1-hexinilo, y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo,
 - (9) grupos alquiniloxi tales como un grupo etiniloxi y un grupo propargiloxi,
- 65 (10) grupos arilo tales como un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, y un grupo 2-naftilo,

5

10

20

25

30

35

40

45

50

55

(11) grupos ariloxi tales como un grupo fenoxi y un grupo 1-naftoxi,

(12) grupos aralquilo tales como un grupo bencilo y un grupo fenetilo,

5	(13) grupos aralquiloxi tales como un grupo benciloxi y un grupo fenetiloxi,
	(14) grupos acilo tales como un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzoílo, un grupo ciclohexilcarbonilo, y un grupo ftaloílo,
10	(15) grupos alcoxicarbonilo tales como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo isopropoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, y un grupo t-butoxicarbonilo,
	(16) grupos carboxilo,
15	(17) grupos hidroxilo,
20	(18) grupos haloalquilo tales como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo, un grupo perfluoro-n-pentilo, grupos haloalcoxi tales como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi, y un grupo trifluorometoxi,
20	(19) grupos haloalquenilo tales como un grupo 2-cloro-1-propenilo y un grupo 2-fluoro-1-butenilo,
25	(20) grupos haloalquinilo tales como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, un grupo 4-fluoro-1-pentinilo, y un grupo 5-bromo-2-pentinilo,
20	(21) grupos haloalqueniloxi tales como un grupo 2-cloro-1-propeniloxi y un grupo 3-bromo-2-buteniloxi,
	(22) grupos haloalquinilo tales como un grupo 3-cloro-propargilo y un grupo 3-yodo-propargilo,
30	(23) grupos haloalquiniloxi tales como un grupo 3-cloro-propargiloxi y un grupo 3-yodo-propargiloxi,
	(24) grupos haloarilo tales como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, y un grupo 2,4-diclorofenilo,
35	(25) grupos haloariloxi tales como un grupo 4-fluorofenoxi y un grupo 4-cloro-1-naftoxi,
33	(26) grupos acilo sustituido con halógeno tales como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo, y un grupo 4-clorobenzoílo,
40	(27) grupos alcoxialquilo tales como un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo 1-etoxietilo, y un grupo 2-etoxietilo,
	(28) grupos alcoxialcoxi tales como un grupo metoximetoxi, un grupo etoximetoxi, un grupo 1-etoxietoxi, y un grupo 2-etoxietoxi,
45	(29) grupos ciano,
	(30) grupos isociano,
50	(31) grupos nitro,
30	(32) grupos isocianato,
	(33) grupos cianato,
55	(34) grupos amino,
	(35) grupos alquilamino tales como un grupo metilamino, un grupo dimetilamino, y un grupo dietilamino,
60	(36) grupos arilamino tales como un grupo anilino, un grupo naftilamino, y un grupo antranilamino,
00	(37) grupos aralquilamino tales como un grupo bencilamino y un grupo fenetilamino,
65	(38) grupos alquilsulfonilamino tales como un grupo metilsulfonilamino, un grupo etilsulfonilamino, un grupo n-propilsulfonilamino, un grupo isopropilsulfonilamino, y un grupo n-butilsulfonilamino,
00	(39) grupos arilsulfonilamino tales como un grupo fenilsulfonilamino,

	401	1 4 11 16 11 1			
- 1	7111	ari ince hataroarile iltanilamina	talac	como un aruno	ningrazinile iltonilamino
١	TU	grupos heteroarilsulfonilamino	laics	como um grupo	piperazirii surorii arriirio,

- (41) grupos acilamino tales como un grupo formilamino, un grupo acetilamino, un grupo propanoilamino, un grupo butirilamino, un grupo isopropilcarbonilamino, y un grupo benzoilamino,
 - (42) grupos alcoxicarbonilamino tales como un grupo metoxicarbonilamino y un grupo etoxicarbonilamino,
- (43) grupos haloalquilsulfonilamino tales como un grupo fluorometilsulfonilamino, un grupo clorometilsulfonilamino, un grupo bromometilsulfonilamino, un grupo diclorometilsulfonilamino, un grupo 1,1-difluoroetilsulfonilamino, un grupo trifluorometilsulfonilamino, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilamino, y un grupo pentafluorosulfonilamino,
- (44) grupos bis(alquilsulfonil)amino tales como un grupo bis(metilsulfonil)amino, un grupo bis(etilsulfonil)amino,
 un grupo (etilsulfonil)(metilsulfonil)amino, un grupo bis(n-propilsulfonil)amino, un grupo bis(isopropilsulfonil)amino,
 un grupo bis(n-butilsulfonil)amino, y un grupo bis(t-butilsulfonil)amino,
 - (45) grupos bis(haloalquilsulfonil)amino tales como un grupo bis(fluorometilsulfonil)amino, un grupo bis(clorometilsulfonil)amino, un grupo bis(bromometilsulfonil)amino, un grupo bis(diclorometilsulfonil)amino, un grupo bis(1,1-difluoroetilsulfonil)amino, un grupo bis(trifluorometilsulfonil)amino, un grupo bis(2,2,2-trifluoroetil)amino, y un grupo bis(pentafluoroetilsulfonil)amino,
 - (46) grupos hidrazino no sustituidos o sustituidos tales como un grupo hidrazino, un grupo N'-fenilhidrazino, un grupo N'-metoxicarbonilhidrazino, un grupo N'-acetilhidrazino, y un grupo N'-metilhidrazino,
 - (47) grupos aminocarbonilo no sustituidos o sustituidos tales como un grupo aminocarbonilo, un grupo dimetilaminocarbonilo, un grupo fenilaminocarbonilo, y un grupo N-fenil-N-metilcarbonilo,
- (48) grupos hidrazinocarbonilo no sustituidos o sustituidos tales como un grupo hidrazinocarbonilo, un grupo N'-metilhidrazinocarbonilo, y un grupo N'-fenilhidrazinocarbonilo,
 - (49) grupos iminoalquilo no sustituidos o sustituidos tales como un grupo N-metiliminometilo, un grupo 1-N-feniliminoetilo, un grupo N-hidroxiiminometilo, y un grupo N-metoxiiminometilo,
- 35 (50) grupos tiol,

5

20

25

40

45

55

- (51) grupos isotiocianato,
- (52) grupos tiocianato,
- (53) grupos alquiltio tales como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo s-butiltio, un grupo t-butiltio,
- (54) grupos alqueniltio tales como viniltio, un grupo aliltio,
- (55) grupos alguiniltio tales como un grupo etiniltio y un grupo propargiltio.
- (56) grupos ariltio tales como un grupo feniltio y un grupo naftiltio,
- 50 (57) grupos heteroariltio tales como 2-piperidiltio, un grupo 3-piridaziltio,
 - (58) grupos aralquiltio tales como un grupo benciltio y un grupo fenetiltio,
 - (59) grupos heteroarilalquiltio tales como un grupo 2-piridilmetiltio y un grupo 2-furilmetiltio,
 - (60) grupos alquiltiocarbonilo tales como un grupo metiltiocarbonilo, un grupo etiltiocarbonilo, un grupo isopropiltiocarbonilo, un grupo isopropiltiocarbonilo, un grupo isobutiltiocarbonilo, un grupo s-butiltiocarbonilo, y un grupo t-butiltiocarbonilo,
- 60 (61) grupos alquiltioalquilo tales como un grupo metiltiometilo y un grupo 1-metiltioetilo,
 - (62) grupos ariltioalquilo tales como un grupo feniltiometilo y un grupo 1-feniltioetilo,
 - (63) grupos alquiltioalcoxi tales como un grupo metiltiometoxi y un grupo 1-metiltioetoxi,
 - (64) grupos ariltioalcoxi tales como un grupo feniltiometoxi y un grupo 1-feniltioetoxi,

(65) grupos alquilsulfinilo tales como un grup	o metilsulfinilo, un grupo	o etilsulfinilo, y un grupo	t-butilsulfenilo,
--	----------------------------	-----------------------------	-------------------

- (66) grupos alguenilsulfinilo tales como un grupo alilsulfinilo.
- (67) grupos alquinilsulfinilo tales como un grupo propargilsulfinilo,
- (68) grupos arilsulfinilo tales como un grupo fenilsulfinilo,
- (69) grupos heteroarilsulfinilo tales como un grupo 2-piridilsulfinilo y un grupo 3-piridilsulfinilo,
 - (70) grupos aralquilsulfinilo tales como un grupo bencilsulfinilo y un grupo fenetilsulfinilo,
 - (71) grupos heteroarilalquilsulfenilo tales como un grupo 2-piridilmetilsulfinilo y un grupo 3-piridilmetilsulfinilo,
 - (72) grupos alquilsulfonilo tales como un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, y un grupo t-butilsulfonilo,
 - (73) grupos alquenilsulfonilo tales como un grupo alilsulfonilo,
- 20 (74) grupos alquinilsulfonilo tales como un grupo propargilsulfonilo,
 - (75) grupos arilsulfonilo tales como un grupo fenilsulfonilo,
 - (76) grupos heteroarilsulfonilo tales como 2-piridilsulfonilo y un grupo 3-piridilsulfonilo,
 - (77) grupos aralquilsulfonilo tales como un grupo bencilsulfonilo y un grupo fenetilsulfonilo,
 - (78) grupos heteroarilalquilsulfonilo tales como un grupo 2-piridilmetilsulfonilo y un grupo 3-piridilmetilsulfonilo,
- 30 (79) grupos heterocíclicos de 5 miembros insaturados tales como un grupo furan-2-ilo, un grupo furan-3-ilo, un grupo tiofen-2-ilo, un grupo tiofen-3-ilo, un grupo pirrol-2-ilo, un grupo pirrol-3-ilo, un grupo oxazol-2-ilo, un grupo oxazol-4-ilo, un grupo oxazol-5-ilo, un grupo tiazol-2-ilo, un grupo tiazol-4-ilo, un grupo tiazol-5-ilo, un grupo isooxazol-3-ilo, un grupo isooxazol-4-ilo, un grupo isooxazol-5-ilo, un grupo isotiazol-3-ilo, un grupo isotiazol-4-ilo, un grupo isotiazol-5-ilo, un grupo imidazol-2-ilo, un grupo imidazol-4-ilo, un grupo imidazol-5-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo pirazol-5-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 35 un grupo 1,2,3-triazol-4-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, y un grupo 1,2,4-triazol-5-ilo,
 - (80) grupos heterocíclicos de 6 miembros insaturados tales como un grupo piridin-2-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo piridin-4-ilo, un grupo 5-cloro-3-piridilo, un grupo 3-trifluorometil-2-piridilo, un grupo piridazin-3-ilo, un grupo piridazin-4-ilo, un grupo pirazin-2-ilo, un grupo pirimidin-5-ilo, un grupo 1,3,5-triazin-2-ilo, y un grupo 1,2,4-triazin-3-ilo,
 - (81) grupos heterocíclicos saturados o parcialmente saturados tales como un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo tetrahidropiran-4-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo morfolino, un grupo piperidino, un grupo N-metilpiperazino, y un grupo oxazolin-2-ilo,
 - (82) grupos heterociclicoxi tales como un grupo 2-piridiloxi y un grupo 3-isooxazoliloxi,
 - (83) grupos heteroarilalquilo tales como un grupo 2-piridilmetilo y un grupo 3-piridilmetilo, y
 - (84) grupos heteroarilalcoxi tales como un grupo 2-piridilmetoxi y un grupo 3-piridilmetoxi.

Estos sustituyentes ejemplificados en (1) a (84) pueden también estar sustituidos con aquellos ejemplificados en (1) a (84).

Los ejemplos específicos del grupo arilo sustituido incluyen un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, un grupo 3,5-diclorofenilo, un grupo 2,6-difluorofenilo, un grupo 4-metoxifenilo, y un grupo 3,4-dimetoxifenilo.

Entre estos, X es preferentemente un átomo de halógeno.

n1 representa uno cualquiera de números enteros de 0 a 5, y preferiblemente uno cualquiera de números enteros de 0 a 3.

Cuando n1 es 2 o más, X(s) puede ser igual o diferente entre sí.

A representa un grupo tetrazoílo representado por la fórmula (2) o la fórmula (3), y preferiblemente la fórmula (2).

8

5

10

15

25

40

45

50

55

60

En las fórmulas (2) y (3), Y representa un grupo alquilo de C_{1-8} . Ejemplos del grupo alquilo de C_{1-8} incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo i-butilo, un grupo n-pentilo, y un grupo n-hexilo.

Entre estos, Y es preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₃, y de manera particularmente preferible un grupo metilo.

Het representa un grupo piridilo representado por la fórmula (4).

- En la fórmula (4), al menos un R representa, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo formilo, un grupo carboxilo, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de C₂₋₈ no sustituido, un grupo alquinilo de C₂₋₈ no sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, OR¹, S(O)_mR¹, COR¹, o CO₂R¹.
 - Los ejemplos específicos del átomo de halógeno, del grupo alquilo de C₁₋₈ del grupo alquilo de C₁₋₈ alquilo no sustituido o sustituido, y del grupo arilo del grupo arilo no sustituido o sustituido para R son los mismos que para X.
- Los ejemplos específicos del grupo alquenilo de C₂₋₈ del grupo alquenilo de C₂₋₈ no sustituido o sustituido para R incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 3-penteni
- Los ejemplos específicos del grupo alquinilo de C₂₋₈ del grupo alquinilo de C₂₋₈ no sustituido o sustituido para R incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo.
 - Los ejemplos específicos del grupo heterocíclico del grupo heterocíclico no sustituido o sustituido para R incluyen los grupos heterocíclicos de 5 miembros insaturados tales como un grupo furan-2-ilo, un grupo furan-3-ilo, un grupo tiofen-2-ilo, un grupo tiofen-2-ilo, un grupo pirrol-2-ilo, un grupo pirrol-3-ilo, un grupo oxazol-2-ilo, un grupo oxazol-4-ilo, un grupo oxazol-5-ilo, un grupo tiazol-5-ilo, un grupo isooxazol-3-ilo, un grupo isooxazol-4-ilo, un grupo isooxazol-3-ilo, un grupo isooxazol-4-ilo, un grupo imidazol-2-ilo, un grupo imidazol-5-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo 1,3,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-4-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo piridin-2-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo 1,3,5-triazin-2-ilo, y un grupo 1,2,4-triazin-3-ilo; y los grupos heterocíclicos saturados o parcialmente saturados tales como un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo piperidin-3-il
 - Como el sustituyente del grupo amino, del grupo alquilo de C_{1-8} , del grupo alquenilo de C_{2-8} , del grupo arilo, y del grupo heteroarilo, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X.
- Los ejemplos específicos del grupo amino sustituido incluyen un grupo metilamino, un grupo dimetilamino, un grupo metiletilamino, un grupo dietilamino, un grupo t-butoxicarbonilmetilamino, un grupo t-butoxicarbonilamino, un grupo acetiletilamino, y un grupo benzoilmetilamino.
- Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido incluyen un grupo clorometilo, un grupo metoximetilo, un grupo metiltiometilo, un grupo metiltiometilo, un grupo dimetilaminometilo, un grupo trifluorometilo, y un grupo 2-cloroetilo.
 - Los ejemplos específicos del grupo alquenilo de C_{2-8} sustituido incluyen un grupo 2-cloroetenilo, un grupo 2-fluoroetenilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-pentenilo, un grupo 1,2,2-trifluoroetenilo, un grupo 2,3,3-trifluoro-2-propenilo, un grupo 2,3,3-triyodo-2-propenilo, y un grupo 2-metoxietenilo.
 - Los ejemplos específicos del grupo alquinilo de C_{2-8} sustituido incluyen un grupo 2-cloroetinilo, un grupo 3-fluoro-1-propinilo, un grupo 3-fluoro-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo.

65

60

5

15

35

40

Los ejemplos específicos del grupo arilo sustituido incluyen un grupo 4-clorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, un grupo 3,4-diclorofenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 3,4-dimetoxifenilo, un grupo 3,4-metilenedioxifenilo, un grupo 4-trifluorometoxifenilo, y un grupo 4-metoxi-1-naftilo.

- 5 Los ejemplos específicos del grupo heterocíclico sustituido incluyen un grupo 3-trifluorometilpiridin-2-ilo, un grupo 4-trifluorometoxi-2-piridilo, un grupo 3-metil-1-pirazolilo, un grupo 4-trifluorometil-1-imidazolilo, y un grupo 3,4-difluoropirrolidino.
- R^1 de OR^1 , COR^1 , $S(O)_mR^1$, y CO_2R^1 para R representa un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1-8} no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C_{2-8} no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de C_{2-8} no sustituido o sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, o un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido.
- Como ejemplos específicos del grupo amino no sustituido o sustituido, el grupo alquilo de $C_{1.8}$ no sustituido o sustituido, el grupo alquinilo de $C_{2.8}$ no sustituido o sustituido, el grupo alquinilo de $C_{2.8}$ no sustituido o sustituido, el grupo arilo no sustituido o sustituido, y el grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos que aquellos para R.
- Los ejemplos específicos del grupo cicloalquilo de C_{3-8} del grupo cicloalquilo de C_{3-8} no sustituido o sustituido incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, y un grupo ciclohexilo.
 - Los ejemplos específicos del grupo cicloalquilo de C₃₋₈ sustituido incluyen un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2-cloro-ciclopropilo, un grupo 2-trifluorometilciclobutilo, un grupo 2,3,4-trifluorociclopentilo, y un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo.
 - Los ejemplos específicos de OR¹ incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo t-butoxi, un grupo metoximetoxi, un grupo 2-metoxietoxi, un grupo 1-etoxietoxi, un grupo viniloxi, un grupo 1-propeniloxi, un grupo 2-propeniloxi, un grupo etiniloxi, un grupo 1-propiniloxi, un grupo 2-propiniloxi, un grupo aminooxi, un grupo metilaminooxi, un grupo dietilaminooxi, un grupo metoxicarbonilaminooxi, un grupo fenoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo pentafluoroetoxi, y un grupo 2-fluoroetoxi.
- Los ejemplos específicos de COR¹ incluyen un grupo acetilo, un grupo benzoílo, un grupo propanoílo, un grupo ipropilcarbonilo, un grupo t-butilcarbonilo, un grupo ciclopropilcarbonilo, un grupo ciclobutilcarbonilo, un grupo
 ciclopentilcarbonilo, un grupo vinilcarbonilo, un grupo 1-propenilcarbonilo, un grupo 2-propenilcarbonilo, un grupo 3-butenilcarbonilo, un grupo
 metilaminocarbonilo, un grupo dimetilaminocarbonilo, un grupo N-metil-N-etilaminocarbonilo, un grupo
 aziridinocarbonilo, un grupo azetidinocarbonilo, un grupo piprolidinocarbonilo, un grupo piperidinocarbonilo, un grupo
 morfolinocarbonilo, un grupo piperazinocarbonilo, y un grupo N-metilpiperazinocarbonilo.
 - Los ejemplos específicos de CO₂R¹ incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo trifluorometoxicarbonilo, un grupo 1-penteniloxicarbonilo, un grupo 2-propiniloxicarbonilo, y un grupo fenoxicarbonilo.
 - Los ejemplos específicos de S(O)_mR¹ para R incluyen un grupo dimetilaminotio, un grupo clorometiltio, un grupo 3-buteniltio, un grupo etiniltio, un grupo 3-metilfeniltio, un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo 1-butenilsulfinilo, un grupo n-hexilsulfinilo, un grupo 2,3-dimetilfenilsulfinilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo 2-metil-2-butenilsulfonilo, un grupo 2-propinilsulfonilo, un grupo 2-naftilsulfonilo, un grupo fenilsulfonilo, un grupo 2-nitrofenilsulfonilo, y un grupo p-tolilsulfonilo.
 - Entre estos, resultan preferidos un átomo de halógeno, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈, OR₁, y SR₁, y son más preferidos un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈, OR₁, y SR₁.
 - Un grupo amino y un grupo dialquilamino se pueden ejemplificar preferiblemente como el grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1-4} se puede ejemplificar preferentemente como el grupo alquilo de C_{1-8} , un grupo alcoxi de C_{1-4} se puede ejemplificar preferentemente como OR_1 , y un grupo alquiltio de C_{1-4} se puede ejemplificar preferiblemente como SR_1 .
 - m representa uno cualquiera de números enteros de 0 a 2.

25

30

45

50

55

60

65

- n2 representa uno cualquiera de números enteros de 0 a 3.
- Cuando n2 es 2 o más, varios R(s) pueden ser iguales o diferentes entre sí.

Q¹, como se menciona en la presente memoria, representa un grupo haloalquilo de C₁₋₈, un grupo haloalquenilo de C_{2-8} , un grupo alquinilo de C_{2-8} , un grupo haloalquinilo de C_{2-8} , un grupo haloalcoxi de C_{1-8} , un grupo alquenil C_{2-8} -oxi, un grupo haloalquenil C₂₋₈-oxi, un grupo alquinil C₂₋₈-oxi, un grupo haloalquinil C₂₋₈-oxi, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxicarbonilamino, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo alcoxi de C₁₋₈ ramificado sustituido con un grupo arilo sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilo sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2.8-oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C_{1.8} sustituido con un grupo alquil C_{1.8}-sulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alguil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alcoxi de C_{1.8} que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo aralguilo no sustituido o sustituido), un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido).

5

10

15

20

Los ejemplos específicos del grupo haloalquilo de C₁₋₈ para Q¹ incluyen un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo, y un grupo perfluoro-n-pentilo.

Los ejemplos específicos del grupo haloalquenilo de C_{2-8} para Q^1 incluyen un grupo 1-clorovinilo, un grupo 2-bromovinilo, un grupo 3-fluoroalilo, y un grupo 2-fluorocrotilo.

- Los ejemplos específicos del grupo alquinilo de C₂₋₈ para Q¹ incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo.
- Los ejemplos específicos del grupo haloalquinilo de C_{2-8} para Q^1 incluyen un grupo cloroetinilo, un grupo bromoetinilo, un grupo 3-cloro-1-propinilo, un grupo 3-cloro-1-butinilo, y un grupo 3-bromo-1-butinilo.
- Los ejemplos específicos del grupo haloalcoxi de C₁₋₈ para Q¹ incluyen un grupo clorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo 1,1-difluoroetoxi, y un grupo hexafluoroetoxi.
 - Los ejemplos específicos del grupo alqueniloxi de $C_{2.8}$ para Q^1 incluyen un grupo eteniloxi, un grupo 1-metiloxi, un grupo 1-metiloxi, un grupo 1-metiloxi, un grupo 1-metiloxi.
- Los ejemplos específicos del grupo haloalqueniloxi de C₂₋₈ para Q¹ incluyen un grupo 3-cloro-2-propeniloxi, un grupo 3,3-dicloro-2-propeniloxi, un grupo 4-cloro-2-buteniloxi, un grupo 4,4-dicloro-3-buteniloxi, y un grupo 4,4-difluoro-3-buteniloxi.
- Los ejemplos específicos del grupo alquiniloxi de C₂₋₈ para Q¹ incluyen un grupo 2-propiniloxi, un grupo 2-butiniloxi, y un grupo 1-metil-2-propiniloxi.
 - Los ejemplos específicos del grupo haloalquiniloxi de C_{2-8} para Q^1 incluyen un grupo 2-cloroetiniloxi, un grupo 3-cloro-2-propiniloxi, y un grupo 3-fluoro-2-propiniloxi.
- Los ejemplos específicos del grupo alcoxicarbonilo del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxicarbonilamino para Q¹ incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo isopropoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, y un grupo t-butoxicarbonilo. Como el alcoxi de C₁₋₈, por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos alcoxi que aquellos para X. En adelante, ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ son los mismos ejemplos específicos. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxicarbonilamino incluyen un grupo N-metoxicarbonilaminometoxi, un grupo N-t-butoxicarbonilaminometoxi, un grupo 2-(N-t-butoxicarbonil-N-bencilamino)etoxi.
- Los ejemplos específicos del grupo cicloalquilo de C_{3-8} del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo cicloalquilo de C_{3-8} para Q^1 incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, y un grupo cicloheptilo. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo cicloalquilo de C_{3-8}

incluyen un grupo ciclopropilmetoxi, un grupo 1-ciclopropil-etoxi, un grupo ciclohexilmetoxi, y un grupo 2-ciclohexil-etoxi.

Los ejemplos específicos del grupo acoxi de C₁₋₈ ramificado sustituido con un grupo arilo no sustituido incluyen un grupo 1-feniletoxi, un grupo 1-fenil-1-metiletoxi, y un grupo 2-fenil-1-metiletoxi.

5

10

25

40

45

50

55

Como el grupo arilo del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilo sustituido para Q^1 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos arilo que aquellos para X. El sustituyente del grupo arilo no está limitado particularmente, y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente acetable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilo sustituido incluyen un grupo 2-metilfenilmetoxi, un grupo 3-metilfenilmetoxi, un grupo 4-clorofenilmetoxi, un grupo 3-clorofenilmetoxi, un grupo 2-metoxifenilmetoxi, un grupo 3-fenilfenilmetoxi, un grupo 3-fenilfenilmetoxi.

Como el grupo heterocíclico del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido para Q¹, por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos heterocíclicos que aquellos para R. El sustituyente del grupo heterociclo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente acetable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido incluyen un grupo 2-piridilmetoxi, un grupo 6-metilpiridin-2-ilmetoxi, un grupo 4-piridilmetoxi, un grupo 1-(4-piridil)-1-metiletoxi, un grupo 2-oxazolilmetoxi, y un grupo 2-benzoxazolilmetoxi.

El sustituyente del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} no sustituido o sustituido para Q^1 no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} no sustituido o sustituido incluyen un grupo metoximetoxi, un grupo etoximetoxi, un grupo 2-(metoxietoxi)etoxi, un grupo 2-trifluorometoxietoxi, y un grupo 2-pentafluoroetoxietoxi.

Los ejemplos específicos del grupo ariloxi del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido para Q¹ incluyen un grupo fenoxi y un grupo 1-naftoxi. El sustituyente del grupo ariloxi no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo fenoximetoxi, un grupo 2-fenoxietoxi, un grupo 2-(4-metoxifenoxi)etoxi.

Como el grupo aralquiloxi del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido para Q^1 , por ejemplo, se pueden ejemplificar un grupo benciloxi y un grupo fenetiloxi. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo benciloximetoxi, un grupo 2-benciloxietoxi, un grupo fenetiloximetoxi, y un grupo (4-clorofenilmetoxi)metoxi.

Como el grupo arilo del grupo alquiniloxi de C_{2-8} sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido para Q^1 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos arilo que aquellos para X. Como el grupo alquiniloxi de C_{2-8} , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos alquinilo que aquellos para R. El sustituyente del grupo arilo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Ejemplos específicos del grupo alquiniloxi de C_{2-8} sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido incluyen un grupo 3-fenil-2-propiniloxi, un grupo 1-fenil-2-propiniloxi, y un grupo 3-fenil-1,1-dimetil-2-propiniloxi.

Los ejemplos específicos del grupo alquiltio del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -tio no sustituido o sustituido para Q^1 incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo isobutiltio, un grupo s-butiltio. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -tio no sustituido o sustituido incluyen un grupo metiltiometoxi, un grupo metiltio-n-butoxi, y un grupo 1-metiltioetoxi.

60 Los ejemplos específicos del grupo ariltio del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido para Q¹ incluyen un grupo feniltio y un grupo naftiltio. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arillo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido incluyen un grupo feniltiometoxi, un grupo 2-feniltioetoxi, un grupo naftiltiometoxi, y un grupo 1-feniltioetoxi.

Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfinilo del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -sulfinilo no sustituido para Q^1 incluyen un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, y un grupo t-butilsulfinilo. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquilsulfinilo de C_{1-8} sustituido o no sustituido incluyen un grupo metilsulfinilmetoxi, un grupo metilsulfinil-n-butoxi, y un grupo 1-metilsulfiniletoxi.

Los ejemplos específicos del grupo arilsulfinilo del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido para Q¹ incluyen un grupo fenilsulfenilo. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido incluyen un grupo fenilsulfinilmetoxi, un grupo 2-fenilsulfiniletoxi, un grupo naftilsulfinilmetoxi, y un grupo 1-fenilsulfeniletoxi.

Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfonilo del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido para Q¹ incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, y un grupo t-butilsulfonilo. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido incluyen un grupo metilsulfonilmetoxi, un grupo metilsulfonil-n-butoxi, y un grupo 1-metilsulfoniletoxi.

Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido para Q^1 incluyen un grupo fenilsulfonilo. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido incluyen un grupo fenilsulfonilmetoxi, un grupo 2-fenilsulfoniletoxi, un grupo naftilsulfonilmetoxi, y un grupo 1-fenilsulfoniletoxi.

Los ejemplos específicos del grupo aralquilo del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido para Q¹ incluyen un grupo bencilo, un grupo fenetilo, y un grupo 1-naftilmetilo. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido) incluyen un grupo aminometoxi, un grupo 3-aminopropoxi, un grupo 6-aminohexiloxi, un grupo 1-aminoetoxi, un grupo bencilaminometoxi, un grupo N-bencil-N-metilaminometoxi, y un grupo N-bencil-N-metoxicarbonilaminometoxi.

Como el grupo alquilo del grupo alcoxi de C_{1-8} que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido) para Q^1 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos alquilo que aquellos para X. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido) incluyen un grupo metilaminometoxi, un grupo 3-metilaminopropoxi, un grupo 6-metilaminohexiloxi, un grupo 1-metilaminoetoxi, un grupo dimetilaminometoxi, un grupo 2-etilaminoetoxi, y un grupo N-metil-N-metoxicarbonilaminometoxi.

El sustituyente del grupo ariloxi sustituido o no sustituido para Q¹ no está limitado particularmente, y se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo ariloxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo fenoxi, un grupo naftiloxi, un grupo 4-clorofenoxi, un grupo 4-metoxifenoxi, un grupo 2,4-diclorofenoxi, y un grupo 2-trifluorometilfenoxi.

Como el grupo alquilo de C_{1-8} del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo carboxilo para Q^1 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos sustituyentes que aquellos del grupo alquilo para X. En adelante, Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} son los mismos ejemplos específicos. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo carboxilo incluyen un grupo 2-carboxietilo y un grupo 6-carboxihexilo.

Los ejemplos específicos del grupo aralquilo del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido) para Q^1 incluyen un grupo bencilo, un grupo fenetilo, y un grupo 1-naftilmetilo. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido) incluyen un grupo aminometilo, un grupo 3-aminopropilo, un grupo 6-aminohexilo, un grupo 1-aminoetilo, un grupo bencilaminometilo, un grupo N-bencil-N-metilaminometilo, y un grupo N-bencil-N-metoxicarbonilaminometilo.

65

60

5

10

25

30

35

40

45

50

Como el grupo alquilo del grupo alquilo de C_{1-8} que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido) para Q^1 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos alquilo que aquellos para X. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C_{1-8} que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido) incluyen un grupo metilaminometilo, un grupo 3-metilaminopropilo, un grupo 6-metilaminohexilo, un grupo 1-metilaminoetilo, un grupo dimetilaminometilo, un grupo 2-etilaminoetilo, y un grupo N-metil-N-metoxicarbonilaminometio.

5

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

Los ejemplos específicos del grupo ariloxi del grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido para Q¹ incluyen un grupo fenoxi y un grupo naftiloxi. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo fenoximetilo, un grupo naftiloximetilo, un grupo 2-fenoxietilo, y un grupo 1-fenoxietilo.

Los ejemplos específicos del grupo acilo del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo acilo para Q^1 incluyen un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzoílo, un grupo ciclohexilcarbonilo, y un grupo ftaloilo. Los ejemplos específicos del grupo acilo del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo acilo incluyen un grupo 4-acetil-n-butilo, un grupo acetilmetilo, un grupo 1-acetiletilo, y un grupo 3-benzoil-n-propilo.

Como el grupo heterociclicoxi del grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido para Q¹, por ejemplo, se pueden ejemplificar aquellos en los que un átomo de oxígeno está enlazado a la posición enlazante de aquellos del grupo heterocíclico para R. El sustituyente del heterociclo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo 2-piridiloximetilo, un grupo 2-(2-piridiloxi)etilo, un grupo 1-(2-piridiloxi)etilo, un grupo 4-piperaziloximetilo.

Entre estos, Q1 es preferentemente un grupo alqueniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es un carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2-propeniloxi, un grupo alquiniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es un carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2-butiniloxi, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxicarbonilamino, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo alcoxi de C_{1.8} ramificado sustituido con un grupo arilo no sustituido, un grupo alcoxi de C_{1.8} sustituido con un grupo arilo sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-8-oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alcoxi de C_{1.8} que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido, y más preferiblemente un grupo alqueniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es un carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2propeniloxi, un grupo alquiniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es un carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2-butiniloxi, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo alcoxi de C₁₋₈ ramificado sustituido con un grupo arilo no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilo sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido, un grupo alquinil C2.8-oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C1.8 sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alcoxi de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con

un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido.

Adicionalmente, el grupo alqueniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es un carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2-propeniloxi, es preferiblemente un grupo 1,1-dialquil-alquenilo sustituido, el grupo alquiniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es un carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2butiniloxi, es preferiblemente un grupo 1,1-dialquil-alquiniloxi sustituido, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈ es preferiblemente un grupo cicloalquilo de C₃₋₆, alquilo de C₁₋₂, el grupo alcoxi de C₁₋₈ ramificado sustituido con un grupo arilo no sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ ramificado sustituido con un grupo arilo no sustituido en la posición 1 o 2, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilo sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ que está sustituido con un grupo arilo sustituido con un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi, un grupo alquilo, un grupo arilo, o un grupo alquilsulfonilo, más preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ que está sustituido con un grupo arilo sustituido en la posición 2 o 3 del grupo arilo, y aún más preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₄ que está sustituido con un grupo arilo sustituido con un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi, un grupo alquilo, un grupo arilo, o un grupo alquilsulfonilo en la posición 2 o 3, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ sustituido con un grupo heterocíclico aromático no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₄ no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ sustituido con un grupo fenoxi no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ sustituido con un grupo benciloxi no sustituido o sustituido, el grupo alquiniloxi de C₂₋₈ sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo 1,1-dialquil-alquiniloxi de C2-8 sustituido con un grupo fenilo no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ sustituido con un grupo alquiltio de C₁₋₄ no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido) es preferiblemente un grupo alcoxi de C₁₋₄ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), el grupo alcoxi de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido) es preferiblemente alcoxi de C₁₋₄ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un ((grupo bencilo o grupo fenetilo) no sustituido o sustituido), el grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido) es preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un ((grupo bencilo o grupo fenetilo) no sustituido o sustituido), el grupo alquilo de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido) es preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₄ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), el grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con un grupo fenoxi no sustituido o sustituido, el grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo acilo es preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con un grupo formilo o un grupo alquilcarbonilo, o el grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido es preferiblemente un grupo alquilo de C₁₋₄ sustituido con un grupo heterociclicoxi aromático no sustituido o sustituido.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

Q², como se menciona en la presente memoria, representa un átomo de hidrógeno, un grupo haloalquilo de C_{1.8}, un grupo alquenilo de C_{2-8} , un grupo haloalquenilo de C_{2-8} , un grupo alquinilo de C_{2-8} , un grupo haloalquinilo de C_{2-8} , un grupo haloalquinil grupo alcoxi de C₁₋₈, un grupo haloalcoxi de C₁₋₈, un grupo alquenil C₂₋₈-oxi, un grupo haloalquenil C₂₋₈-oxi, un grupo alquinil $C_{2.8}$ -oxi, un grupo haloalquinil $C_{2.8}$ -oxi, un grupo cicloalquilo de $C_{3.8}$, un grupo cicloalquil $C_{3.8}$ -oxi, un grupo alquilamino C₁₋₈, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋ 8 sustituido con un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C₂₋₈oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1.8} sustituido con un grupo alquil C_{1.8}tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C_{1.8}-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1.8} sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o

Los ejemplos específicos del grupo haloalquilo de C_{1-8} , del grupo haloalquenilo de C_{2-8} , del grupo alquinilo de C_{2-8} , el grupo haloalquinilo de C_{2-8} , el grupo haloalquiniloxi de C_{2-8} , el grupo haloalquiniloxi de C_{2-8} , el grupo haloalquiniloxi de C_{2-8} , el grupo alquiniloxi de C_{2-8} , el grupo alquiniloxi de C_{2-8} , el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo cicloalquilo de C_{3-8} , el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo ariloxi no sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, el

grupo alquiniloxi de C_{2-8} sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -tio no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilito sustituido o no sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquilsulfinilo de C_{1-8} no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, el grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, el grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo ariloxi no sustituido, el grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo carboxilo, el grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, el grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido para Q^2 incluyen los mismos ejemplos específicos que aquellos de Q^1 .

10

5

Los ejemplos específicos del grupo cicloalquilo de C_{3-8} para Q^2 incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclohexilo, un gr

15

Los ejemplos específicos del grupo cicloalquil $C_{3.8}$ -oxi para Q^2 incluyen un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclohexiloxi, un grupo ciclohexiloxi.

Lo

Los ejemplos específicos del grupo alquil C_{1-8} -amino para Q^2 incluyen un grupo metilamino, un grupo dietilamino, un grupo di n-heptilamino, y un grupo t-butilamino.

20

El sustituyente del grupo amino del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido para Q^2 no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido incluyen un grupo 2-aminoetoxi, un grupo 6-aminohexiloxi, un grupo N-acetilaminometoxi, un grupo 2-(N-acetilamino)etoxi, un grupo 1-(N-acetilamino)etoxi, un grupo 2-(N-benzoil)aminoetoxi, un grupo N-metoxicarbonilaminometoxi, un grupo N-t-butoxicarbonilaminometoxi, un grupo 2-(N-etoxicarbonilamino)etoxi, y un grupo 2-(N-t-butoxicarbonil-N-bencilamino)etoxi.

25

30

Los ejemplos específicos del grupo aralquiloxi del grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido para Q² incluyen un grupo benciloxi, un grupo fenetiloxi, y un grupo 1-naftilmetoxi. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo benciloxi, un grupo fenetiloxi, un grupo 1-feniletoxi, un grupo 1-feniletoxi, un grupo 1-feniletoxi, un grupo 2-metilfenilmetoxi, un grupo 3-metilfenilmetoxi, un grupo 3-metoxifenilmetoxi, un grupo 3-metoxifenilmetoxi, un grupo 3-metoxifenilmetoxi, un grupo 3-metoxifenilmetoxi, un grupo 3-fenilfenilmetoxi.

35

Los ejemplos específicos del grupo alquiltio del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -tio no sustituido o sustituido para Q^2 incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isobutiltio, un grupo s-butiltio, y un grupo t-butiltio. El sustituyente no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -tio no sustituido o sustituido incluyen un grupo metiltiometilo, un grupo metiltio-n-butilo, y un grupo 1-metiltioetilo.

45

50

40

Como el grupo alcoxi del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi no sustituido o sustituido para Q^2 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos grupos alcoxi que aquellos para X. El sustituyente del mismo no está limitado particularmente y, por ejemplo, se pueden ejemplificar en un intervalo químicamente aceptable los mismos sustituyentes que aquellos del grupo arilo para X. Los ejemplos específicos del grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi no sustituido o sustituido incluyen un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo 2-isopropoxietilo, un grupo n-propoxietilo, un grupo t-butoxi-i-butilo, un grupo 2-(2-metoxietoxi)etilo, un grupo 2-pentafluoroetoxietilo.

55

60

65

Entre estos, Z es preferentemente un grupo representado por la fórmula: $Q^2C(=0)NH$ -, y Q^2 es preferiblemente un grupo haloalquenilo de $C_{2\cdot8}$, un grupo alquinilo de $C_{2\cdot8}$, un grupo haloalquenilo $C_{2\cdot8}$ -oxi, un grupo haloalquenilo $C_{2\cdot8}$ -oxi, un grupo haloalquenilo con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alquilo no sustituido), un grupo alcoxi de $C_{1\cdot8}$ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo alcoxi de $C_{1\cdot8}$ sustituido con un grupo alcoxi de $C_{1\cdot8}$ sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de $C_{1\cdot8}$ sustituido con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo aralquilo con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo aralquilo con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo aralquilo con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo aralquilo con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo alquinilo con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo alquinilo con un grupo alquinilo $C_{2\cdot8}$ -oxi sustituido con un grupo alquinilo con un grupo alquinilo

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

60

65

sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido, y más preferiblemente un grupo alquiniloxi, en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2-propeniloxi, un grupo alquiniloxi en el que el carbono unido al átomo de oxígeno es carbono terciario, tal como un grupo 1,1-dimetil-2-butiniloxi, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo alcoxi de C₁₋₈ ramificado sustituido con un grupo arilo no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilo sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-8-oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈ tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo alguilo no sustituido o sustituido), un grupo alcoxi de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino que está no sustituido o sustituido con un (grupo aralquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ que está sustituido con un grupo amino sustituido con un (grupo alquilo no sustituido o sustituido), un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido.

Como grupos funcionales anteriores más preferidos, se pueden ejemplificar los mismos que aquellos para Q¹.

Cuando n2 es 1 o más y al menos un R es un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo formilo, un grupo carboxilo, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1.8} no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de C₂₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de C₂₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, OR¹, S (O)_mR¹, COR¹, o CO₂R¹, o n2 es 2 o más y al menos dos R(s) son átomos de halógeno, Z representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino, o un grupo representado por la fórmula: Q³C(=O)NH- (en la que Q³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁₋₈, un grupo haloalquilo de C₁₋₈, un grupo alquenilo de C₂₋₈, un grupo haloalquenilo de C₂₋₈, un grupo alquinilo de C₂₋₈, un grupo haloalquinilo de C₂₋₈, un grupo alcoxi de C₁₋₈, un grupo haloalcoxi de C₁₋₈, un grupo alquenil $C_{2.8}$ -oxi, un grupo haloalquenil $C_{2.8}$ -oxi, un grupo alquinil $C_{2.8}$ -oxi, un grupo haloalquenil C_{2 cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo cicloalquil C₃₋₈-oxi, un grupo alquil C₁₋₈-amino, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-8-oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈sulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈ tio no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1.8} sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido).

Como el grupo alquilo de C_{1-8} para Q^3 , por ejemplo, se pueden ejemplificar los mismos que aquellos del grupo alquilo de C_{1-8} para X.

Como ejemplos específicos de otro grupo funcional contenido en Q³, se pueden ejemplificar los mismos que aquellos para Q².

Entre estos, resulta preferida la fórmula: $Q^3C(=O)NH$ -. Entre estos, Q^3 es preferentemente un grupo alquilo de C_{1-8} , un grupo haloalquilo de C_{1-8} , un grupo alquenilo de C_{2-8} , un grupo alcoxi de C_{1-8} , un grupo alquenil C_{2-8} -oxi, un grupo alquiniloxi de C_{2-8} , un grupo cicloalquilo de C_{3-8} , un grupo cicloalquilo C_{3-8} -oxi, un grupo alquiloxi de C_{1-8} -amino, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} no

sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C_{2-8} -oxi sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido con un grupo alquinil C_{2-8} -oxi sustituido con un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo ariloxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -sulfinilo no sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo alquil C_{1-8} -sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1-8} sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alquilo de C_{1-8} sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1-8} sustituido con un grupo alquilo de C_{1-8} sustituid

En el derivado de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1) existen estereoisómeros de isómeros (E) y (Z), en base al doble enlace de carbono-nitrógeno en el resto de oxima. Estos dos estereoisómeros, y una mezcla de los mismos, están incluidos en la presente invención. El producto sintetizado se obtiene habitualmente en forma del isómero (Z) solamente, o una mezcla de isómeros (E) y (Z). Cada uno de los isómeros (E) y (Z) se puede aislar mediante separación y purificación, métodos conocidos tales como cromatografía en gel de sílice. Ambos isómeros (Z) y (E) tienen actividad, y el isómero (Z) es particularmente preferido.

Las sales del compuesto representado por la fórmula (1) no están particularmente limitadas en tanto que sean sales agrícola u hortícolamente aceptables. Los ejemplos de las sales incluyen sales de ácidos inorgánicos, tales como hidrocloruro, nitrato, sulfato, y fosfato; y sales de ácidos orgánicos, tales como acetato, lactato, propionato, y benzoato.

(Método de preparación)

5

10

25

30

35

El derivado de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1) se puede preparar, por ejemplo, mediante el método descrito en el panfleto del documento WO 03/016303.

OH

N

Het
$$-CH_2-L$$
 (7)
 (1)

OH

 $(X)_{n1}$
 $(X)_{n1}$
 $(X)_{n1}$

(En las fórmulas anteriores, A, X, Het y n1 son los mismos como se definen anteriormente, y L representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno).

Es decir, el compuesto representado por la fórmula (1) de la presente invención se puede obtener haciendo reaccionar un compuesto oxímico representado por la fórmula (6) con un compuesto representado por la fórmula (7) en presencia de una base.

- 40 Como la base usada para la reacción, se pueden usar bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidroxido de potasio, hidruro de sodio, carbonato de sodio, y carbonato de potasio; y bases orgánicas tales como trietilamina, 4-(dimetilamino)piridina, y piridina. Estas bases se pueden usar solas, o se pueden usar dos o más tipos de ellas en combinación.
- La cantidad usada de la base es habitualmente de 0,01 a 100 moles, y preferiblemente de 0,1 a 5 moles, por mol del compuesto representado por la fórmula (6).

Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia o ausencia de un disolvente.

50 El disolvente a usar no está particularmente limitado en tanto que sea un disolvente que sea inerte para la presente reacción. Los ejemplos del disolvente incluyen disolventes a base de hidrocarburos, tales como pentano, hexano, heptano, benceno, tolueno, y xileno; disolventes a base de halógenos, tales como diclorometano, cloroformo, y

tetracloruro de carbono; disolventes a base de nitrilos, tales como acetonitrilo y propionitrilo; disolventes a base de éteres, tales como éter dietílico, dioxano, y tetrahidrofurano; y disolventes a base de amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, y N-metilpirrolidona; disolventes a base de sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; agua; y un disolvente mixto de los mismos.

La temperatura de reacción de la reacción está habitualmente en un intervalo de -70 $^{\circ}$ C a +200 $^{\circ}$ C, y preferiblemente de -20 $^{\circ}$ C a +100 $^{\circ}$ C.

El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, pero habitualmente está en un intervalo de 30 minutos a 24 horas.

Las sales del compuesto representado por la fórmula (1) se pueden preparar haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (1) con un ácido mediante un método convencional.

- Tras terminar cualquier reacción, el compuesto objetivo representado por la fórmula (1) y una sal del mismo se pueden aislar llevando a cabo una operación de tratamiento habitual. Si es necesario purificar el producto, se pueden emplear medios de purificación conocidos convencionalmente, tales como destilación, recristalización o cromatografía en columna.
- Los ejemplos específicos del derivado de tetrazoiloxima así preparado representado por la fórmula (1) de la presente invención se muestran en la Tabla 1 a Tabla 4 mostradas más abajo. Las abreviaturas en las tablas tienen los significados mostrados a continuación. Me: metilo, Et: etilo, Pr: propilo, Bu: butilo, Hex: hexilo, i: iso, n: normal, s: secundario, t: terciario, c: ciclo, Ph: fenilo, y Py: piridilo.

25 [Tabla 1]

5

Tabla 1							
Tabla I		4 ,R	n2				
	5 3						
		6 2					
		0-CH2 N	`Z				
		Ń					
		N					
		$\frac{1}{\sqrt{(x)_n}}$	1				
		N-N	•				
		CH ₃					
N⁰	Z	R _{n2}	(X) _{n1}	p.f. °C			
1-1	Н	4-Me	-				
1-2	NH ₂	4-Me	-				
1-3	NH ₂	4-Bu-t	-				
1-4	NH ₂	4-OC ₂ H ₅	-				
1-5	NH ₂	5-CH₃	-				
1-6	NH ₂	4-OCH₃	-				
1-7	NH ₂	4-C ₂ H ₅	-				
1-8	NHCHO	4-Me	-				
1-9	NHCOCH ₃	4-Me	-				
1-10	NHCOC ₂ H ₅	4-Me	-				
1-11	NHCOPr-n	4-Me	-				
1-12	NHCOPr-i	4-Me	-				
1-13	NHCOBu-n	4-Me	-				
1-14	NHCOBu-i	4-Me	-				
1-15	NHCOBu-s	4-Me	-				
1-16	NHCOBu-t	4-Me	-				
1-17	NHCOBu-t	4-one	-				
1-18	NHCOCH ₂ CF ₃	4-Me	-				
1-19	NHCOC ₂ F ₅	4-Me	-				
1-20	NHCOCH₂CH₂F	4-Me	-				
1-21	NHCOC(CH ₃) ₂ CF ₃	4-Me	-				
1-22	NHCOCH ₂ CH ₂ CF ₃	4-Me	-				
1-23	NHCOCH ₂ C ₂ F ₅	4-Me	-				
1-24	NHCOCH ₂ CH=CH ₂	4-Me	-				
1-25	NHCOCH ₂ CH=CMe ₂	4-Me	-				

1-26	NHCOC(CH ₃) ₂ CH=CH ₂	4-Me	•	
1-27	NHCOC(CH ₃) ₂ CH=CHCH ₃	4-Me	-	
1-28	NHCOCH2CH=CHCI	4-Me	-	
1-29	NHCOCH ₂ CH=CHCF ₃	4-Me	-	
1-30	NHCOCH ₂ CI=CI ₂	4-Me	-	

[Tabla 2]

[Tabla 2]				
Tabla 1 (continua	,			
1-31	NHCO(1,1-dimetil-2-propinilo)	4-Me	-	
1-32	NHCO(2-butinilo)	4-Me	-	
1-33	NHCO(1,1-dimetil-2-butinilo)	4-Me	-	
1-34	NHCO(1,1-dimetil-2-pentinilo)	4-Me	-	
1-35	NNCO(1-propinilo)	4-Me	1	
1-36	NHCO(1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo)	4-Me	-	
1-37	NHCO(4,4,4-trifluoro-2-butinilo)	4-Me	-	
1-38	NHCOPr-c	4-Me	-	
1-39	NHCOHex-c	4-Me	-	
1-40	NHCO(CH ₂) ₄ CO ₂ H	4-Me	-	
1-41	NHCOCH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t	4-Me	-	
1-42	NHCOCH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et	4-Me	-	
1-43	NHCOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃	4-Me	-	
1-44	NHCOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Me	-	
1-45	NHCOCH ₂ CH ₂ N(Me)COCH ₃	4-Me	-	
1-46	NHCOCH ₂ CH ₂ NHCOPh	4-Me	-	
1-47	NHCOCH ₂ CH ₂ N(Me)COPh	4-Me	-	
1-48	NHCOCH ₂ CH ₂ NHPh	4-Me	-	
1-49	NHCO(CH ₂) ₄ NH ₂	4-Me	-	
1-50	NHCOCH₂NHCH₂Ph	4-Me	-	
1-51	NHCOCH ₂ N(CH ₂ Ph)(CO ₂ Bu-t)	4-Me	-	
1-52	NHCOCH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₄ CI-4	4-Me	-	
1-53	NHCOCH₂OPh	4-Me	-	
1-54	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ F-3	4-Me	-	
1-55	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ OCF ₃ -3	4-Me	-	
1-56	NHCO(CH ₂) ₄ SMe	4-Me	-	
1-57	NHCOCH ₂ CH ₂ OEt	4-Me	-	
1-58	NHCOCH ₂ CH ₂ OPr-i	4-Me	-	

[Tabla 3]

Tabla 1 (continua	ación)			
1-59	NHCOCH ₂ CH ₂ OBu-i	4-Me	-	
1-60	NHCOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	4-Me	-	
1-61	NHCO ₂ CH ₃	4-Me	-	
1-62	NHCO ₂ C ₂ H ₅	4-Me	-	
1-63	NHCO ₂ Pr-n	4-Me	-	
1-64	NHCO ₂ Pr-i	4-Me	-	
1-65	NHCO₂Bu-n	4-Me	-	
1-66	NHCO ₂ Bu-i	4-Me	-	
1-67	NHCO ₂ Bu-s	4-Me	-	
1-68	NHCO ₂ Bu-t	4-i-Pr	-	68-70
1-69	NHCO₂Bu-t	5-Me	-	60-63
1-70	NHCO ₂ Bu-t	4-t-Bu	-	68-69
1-71	NHCO ₂ Bu-t	4-Me	-	
1-72	NHCO ₂ Bu-t	4-Et	-	42-46
1-73	NHCO ₂ Bu-t	4-CH=CH2	-	
1-74	NHCO ₂ Bu-t	4-OMe	-	151-153
1-75	NHCO ₂ Bu-t	4-OEt	-	54-55
1-76	NHCO ₂ Bu-t	4-OCH ₂ CH ₂ OEt	-	<50
1-77	NHCO ₂ Bu-t	4-OPr-i	-	
1-78	NHCO₂Bu-t	4-OBu-n	-	
1-79	NHCO₂Bu-t	4-SMe	-	142-144
1-80	NHCO₂Bu-t	4-SOMe	-	86-88
1-81	NHCO ₂ Bu-t	4-SO ₂ Me	-	117-118
1-82	NHCO ₂ Bu-t	4-NMe ₂	-	

1-83	NHCO₂Bu-t	4-N (Me) (CO ₂ Bu-t)	-	
1-84	NHCO₂Bu-t	5-CN	-	68-72
1-85	NHCO₂Bu-t	4-CN	-	70-75
1-86	NHCO₂Bu-t	4-morfolino	-	
1-87	NHCO₂Bu-t	5-Ph	-	99-102
1-88	NHCO₂Bu-t	5-CO ₂ C ₂ H ₅	-	74-77
1-89	NHCO₂Bu-t	5-CONHCH ₃	-	

[Tabla 4]

		[1abla 4]		
Tabla 1 (continuación)				
1-90	NHCO₂Bu-t	CF ₃	-	
1-91	NHCO₂Bu-t	5-OH		
1-92	NHCO₂Bu-t	5-SH	-	
1-93	NHCO₂Bu-t	4-CH ₂ CI=CI ₂	-	
1-94	NHCO₂Bu-t	4-etinilo	-	
1-95	NHCO₂Bu-t	4-propargilo	-	
1-96	NHCO₂Bu-t	4-(3-yodo-2-propinilo)	-	
1-97	NHCO₂Bu-t	4-Ph	-	
1-98	NHCO₂Bu-t	4-C ₆ H ₄ OMe-4	-	
1-99	NHCO₂Bu-t	4-(2-piridilo)	-	
1-100	NHCO₂Bu-t	4-(4-CF ₃ -2-oxazolilo)	-	
1-101	NHCO₂Bu-t	4-(3-CF ₃ -5-Cl-2-piridilo)	-	
1-102	NHCO₂Bu-t	4-pirrolidino	-	
1-103	NHCO₂Bu-t	4-COMe	-	
1-104	NHCO₂Bu-t	4-CONHMe	-	
1-105	NHCO₂Bu-t	4-CONMe ₂	-	
1-106	NHCO₂Bu-t	4-COPr-c	-	
1-107	NHCO₂Bu-t	4-COPh	-	
1-108	NHCO₂Bu-t	4-COCH ₂ CH=CH ₂	-	
1-109	NHCO₂Bu-t	4-CO(propargilo)	-	
1-110	NHCO₂Bu-t	4-CO₂Me	-	
1-111	NHCO₂Bu-t	4-CO₂Ph	-	
1-112	NHCO₂Bu-t	4-CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	
1-113	NHCO₂Bu-t	4-CO ₂ (propargilo)	-	
1-114	NHCO₂Bu-t	4-Me	2-Cl	
1-115	NHCO₂Bu-t	4-Me	3-Cl	
1-116	NHCO₂Bu-t	4-Me	4-CI	
1-117	NHCO₂Bu-t	4-Me	24-Cl ₂	

[Tabla 5]

Tabla 1 (cont	inuación)			
1-118	NHCO ₂ Bu-t	4-Me	3,5-Cl ₂	
1-119	NHCO₂Bu-t	4-Me	3,4,5-Cl ₃	
1-120	NHCO₂Bu-t	4-Me	2-Me	
1-121	NHCO₂Bu-t	3,4-diMe	-	
1-122	NHCO₂Bu-t	3,5-diMe	-	
1-123	NHCO₂Bu-t	4,5-diMe	-	
1-124	NHCO₂Bu-t	3,4,5-triMe	-	
1-125	NHCO ₂ Bu-t	3-CI-4-Me	-	
1-126	NHCO₂Bu-t	5-CI-4-Me	-	
1-127	NHCO₂Bu-t	3,5-diCl-4-Me	-	
1-128	NHCO₂Bu-t	3,5-diCl	-	
1-129	NHCO ₂ Bu-t	3,4-diCl	-	
1-130	NHCO ₂ Bu-t	3,4-diF	-	
1-131	NHCO₂Bu-n	4-NH ₂	-	
1-132	NHCO₂Bu-n	4-NHCO₂Bu-t	-	
1-133	NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	4-Me	-	
1-134	NHCO ₂ C ₂ F ₅	4-Me	-	
1-135	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ F	4-Me	-	
1-136	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ CF ₃	4-Me	-	
1-137	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	4-Me	-	
1-138	NHCO ₂ CH ₂ C ₂ F ₅	4-Me	-	
1-139	NHCO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	4-Me	-	

1-140	NHCO ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	4-Me	-	
1-141	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ CH=CH ₂	4-Me	-	
1-142	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ CH=CHCH ₃	4-Me	-	
1-143	NHCO ₂ CH ₂ CH=CHCI	4-Me	-	
1-144	NHCO ₂ CH ₂ CH=CHCF ₃	4-Me	-	
1-145	NHCO ₂ CH ₂ CI=CI ₂	4-Me	-	
1-146	NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-propinilo)	4-Me	-	

[Tabla 6]

Tabla 1 (cor	ntinuación)	[Tubia o]		
1-147	NHCO ₂ (2-butinilo)	4-Me	-	
1-148	NIiCO ₂ (1,1-dimetil-2-butinilo)	4-Me	-	
1-149	NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-pentinilo)	4-Me	-	
1-150	NHCO ₂ (1-propinilo)	4-Me	-	
1-151	NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo)	4-Me	-	
1-152	NHCO ₂ (4,4,4-trifluoro-2-butinilo)	4-Me	-	
1-153	NHCO₂Pr-c	4-Me	-	
1-154	NHCO₂Hex-c	4-Me	-	
1-155	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t	4-Me	-	
1-156	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et	4-Me	-	
1-157	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃	4-Me		
1-158	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂	4-Me	-	
1-159	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N (Me) COCH ₃	4-Me	-	
1-160	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOPh	4-Me	-	
1-161	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N (Me) COPh	4-Me	-	
1-162	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHPh	4-Me	-	
1-163	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ NH ₂	4-Me	-	
1-164	NHCO ₂ CH ₂ NHCH ₂ Ph	4-Me	-	
1-165	NHCO ₂ CH ₂ N(CH ₂ Ph) (CO ₂ Bu-t)	4-Me	-	
1-166	NHCO ₂ CH ₂ C ₃ H ₅ -c	4-Me	-	
1-167	NHCO ₂ CH(CH ₃)C ₃ H ₅ -c	4-Me	-	
1-168	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₁₁ -c	4-Me	-	
1-169	NHCO ₂ CH ₂ Ph	4-Me	-	
1-170	NHCO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Ph	4-Me	-	
1-171	NHCO ₂ CH(CH ₃)Ph	4-Me	-	
1-172	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ Ph	4-Me	-	
1-173	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CF ₃ -4	4-Me	-	

[Tabla 7]

Tabla 1 (continua	ación)	-		
1-174	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CN-4	4-Me	-	
1-175	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CN-3	4-Me		
1-176	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CI-4	4-Me	-	
1-177	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CI-3	4-Me	-	
1-178	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ OMe-3	4-Me	-	
1-179	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ OMe-2	4-Me	-	
1-180	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Me-4	4-Me	-	
1-181	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Me-3	4-Me	-	
1-182	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Me-2	4-Me	-	
1-183	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ SO ₂ Me-4	4-Me	-	
1-184	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ SO ₂ Me-3	4-Me	-	
1-185	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Ph-4	4-Me	-	
1-186	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Ph-3	4-Me	-	
1-187	NHCO ₂ CH ₂ Py-2	4-Me	-	
1-188	NHCO ₂ CH ₂ (6-Me-2-Py)	4-Me	-	
1-189	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ Py-4	4-Me	-	
1-190	NHCO ₂ CH ₂ (2-tiazolilo)	4-Me	-	
1-191	NHCO ₂ CH ₂ (2-benztiazolilo)	4-Me	-	
1-192	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	4-Me	-	
1-193	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	4-Me	-	
1-194	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OPr-i	4-Me	-	
1-195	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OBu-i	4-Me	-	
1-196	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	4-Me	-	

1-197	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	4-i-Pr	-	
1-198	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₆ HCl-4	4-Me	-	
1-199	NHCOCH₂OPh	4-Me	-	
1-200	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ F-3	4-Me	-	
1-201	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ OCF ₃ -3	4-Me	-	
1-202	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Ph	4-Me	-	
1-203	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Ph	4-Me	-	

[Tabla 8]

(continuación)			
NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-fenil-2-pentinilo)	4-Me	-	
NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SMe	4-Me	-	
	4-Me	-	
	4-Me	-	
NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOMe	4-Me	-	
NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOCF ₃	4-Me	-	
	4-Me	-	
NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Me	4-Me	-	
NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ CF ₃	4-Me	-	
NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Ph	4-Me	-	
NHCO₂Ph	4-Me	-	
NHCO ₂ C ₆ H ₄ OMe-4	4-Me	-	
NHCONHMe	4-Me	-	
NHCONHC ₂ H ₅	4-Me	-	
NHCONHPr-n	4-Me	-	
NHCONHBu-t	4-Me	-	
NHCONHBu-s	4-Me	-	
NHCONH(Hex-n)	4-Me	-	
	NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-fenil-2-pentinilo) NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SMe NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SCF ₃ NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SPh NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOMe NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOMe NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOCF ₃ NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Me NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Me NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ CF ₃ NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ CF ₃ NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Ph NHCO ₂ Ph NHCO ₂ Ph NHCO ₂ C ₆ H ₄ OMe-4 NHCONHMe NHCONHC ₂ H ₅ NHCONHPr-n NHCONHBu-t NHCONHBu-t	NHCO2(1,1-dimetil-3-fenil-2-pentinilo) 4-Me NHCO2(CH2)4SMe 4-Me NHCO2(CH2)4SCF3 4-Me NHCO2(CH2)4SPh 4-Me NHCO2(CH2)4SOMe 4-Me NHCO2(CH2)4SOCF3 4-Me NHCO2(CH2)4SOPh 4-Me NHCO2(CH2)4SO2Me 4-Me NHCO2(CH2)4SO2CF3 4-Me NHCO2(CH2)4SO2Ph 4-Me NHCO2Ph 4-Me NHCO2Ph 4-Me NHCONHMe 4-Me NHCONHC2H5 4-Me NHCONHPr-n 4-Me NHCONHBu-t 4-Me NHCONHBu-s 4-Me	NHCO2(1,1-dimetil-3-fenil-2-pentinilo) 4-Me - NHCO2(CH2)4SMe 4-Me - NHCO2(CH2)4SCF3 4-Me - NHCO2(CH2)4SPh 4-Me - NHCO2(CH2)4SOMe 4-Me - NHCO2(CH2)4SOCF3 4-Me - NHCO2(CH2)4SOPh 4-Me - NHCO2(CH2)4SO2Me 4-Me - NHCO2(CH2)4SO2CF3 4-Me - NHCO2(CH2)4SO2Ph 4-Me - NHCO2Ph 4-Me - NHCO2Ph 4-Me - NHCONHMe 4-Me - NHCONHMe 4-Me - NHCONHPr-n 4-Me - NHCONHBu-t 4-Me - NHCONHBu-t 4-Me - NHCONHBu-s 4-Me -

[Tabla 9] Tabla 1 (continuación)

[Tabla 36]

Tabla 3	N-N-	5 4 8 6 2 0-CH ₂ N	² n2 `Z	
	N	CH ₃ (X) _n		
N ^o	Z	R _{n2}	(X) _{n1}	p.f. ºC
3-1	Н	4-Me	-	
3-2	NH ₂	4-Me	-	
3-3	NH ₂	4-Bu-t	-	
3-4	NH ₂	4-OC ₂ H ₅	-	
3-5	NH ₂	5-CH₃	-	
3-6	NH ₂	4-OCH ₃	-	
3-7	NH ₂	4-C ₂ H ₅	-	
3-8	NHCHO	4-Me	-	
3-9	NHCOCH ₃	4-Me	-	
3-10	NHCOC₂H₅	4-Me	-	
3-11	NHCOPr-n	4-Me	-	
3-12	NHCOPr-i	4-Me	=	
3-13	NHCOBu-n	4-Me	=	_
3-14	NHCOBu-i	4-Me	=	
3-15	NHCOBu-s	4-Me	=	
3-16	NHCOBu-t	4-Me	=	
3-17	NHCOBu-t	4-OMe	=	
3-18	NHCOCH ₂ CF ₃	4-Me	=	

3-19	NHCOC ₂ F ₅	4-Me	-	
3-20	NHCOCH ₂ CH ₂ F	4-Me	-	
3-21	NHCOC(CH ₃) ₂ CF ₃	4-Me	-	
3-22	NHCOCH ₂ CH ₂ CF ₃	4-Me	-	
3-23	NHCOCH ₂ C ₂ F ₅	4-Me	-	
3-24	NHCOCH ₂ CH=CH ₂	4-Me	-	
3-25	NHCOCH ₂ CH=CMe ₂	4-Me	-	
3-26	NHCOC(CH ₃) ₂ CH=CH ₂	4-Me	-	
3-27	NHCOC(CH ₃) ₂ CH=CHCH ₃	4-Me	-	
3-28	NHCOCH ₂ CH=CHCI	4-Me	-	
3-29	NHCOCH ₂ CH=CHCF ₃	4-Me	-	
3-30	NHCOCH ₂ CI=CI ₂	4-Me	-	

[Tabla 37]

Tabla 3	3 (continuación)	[Tabla 07]		
3-31	NHCO(1,1-dimetil-2-propinilo)	4-Me	-	
3-32	NHCO(2-butinilo)	4-Me	-	
3-33	NHCO(1,1-dimetil-2-butinilo)	4-Me	-	
3-34	NHCO(1,1-dimetil-2-pentinilo)	4-Me	-	
3-35	NHCO(1-propinilo)	4-Me	-	
3-36	NHCO(1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo)	4-Me	-	
3-37	NHCO(4,4,4-trifluoro-2-butinilo)	4-Me	=	
3-38	NHCOPr-c	4-Me	=	
3-39	NHCOHex-c	4-Me	=	
3-40	NHCO(CH ₂) ₄ CO ₂ H	4-Me	=	
3-41	NHCOCH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t	4-Me	=	
3-42	NHCOCH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et	4-Me	=	
3-43	NHCOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃	4-Me	-	
3-44	NHCOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂	4-Me	=	
3-45	NHCOCH ₂ CH ₂ N(Me)COCH ₃	4-Me	-	
3-46	NHCOCH ₂ CH ₂ NHCOPh	4-Me	=	
3-47	NHCOCH ₂ CH ₂ N(Me)COPh	4-Me	=	
3-48	NHCOCH ₂ CH ₂ NHPh	4-Me	=	
3-49	NHCO(CH ₂) ₄ NH ₂	4-Me	-	
3-50	NHCOCH ₂ NHCH ₂ Ph	4-Me	=	
3-51	NHCOCH ₂ N(CH ₂ Ph)(CO ₂ Bu-t)	4-Me	=	
3-52	NHCOCH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₄ CI-4	4-Me	-	
3-53	NHCOCH₂OPh	4-Me	-	
3-54	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ F-3	4-Me	-	
3-55	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ OCF ₃ -3	4-Me	-	
3-56	NHCO(CH ₂) ₄ SMe	4-Me	-	
3-57	NHCOCH ₂ CH ₂ OEt	4-Me	-	
3-58	NHCOCH ₂ CH ₂ OPr-i	4-Me	-	

[Tabla 38]

Tabla 3 (continua				
3-59	NHCOCH ₂ CH ₂ OBu-i	4-Me	-	
3-60	NHCOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	4-Me	-	
3-61	NHCO ₂ CH ₃	4-Me	-	
3-62	NHCO ₂ C ₂ H ₅	4-Me	-	
3-63	NBCO ₂ Pr-n	4-Me	-	
3-64	NHCO ₂ Pr-i	4-Me	-	
3-65	NHCO₂Bu-n	4-Me	-	
3-66	NHCO₂Bu-i	4-Me	-	
3-67	NHCO ₂ Bu-s	4-Me	-	
3-68	NHCO ₂ Bu-t	4-i-Pr	-	
3-69	NHCO ₂ Bu-t	5-Me	-	
3-70	NHCO ₂ Bu-t	4-t-Bu	-	
3-71	NHCO₂Bu-t	4-Me	-	
3-72	NHCO₂Bu-t	4-Et	-	
3-73	NHCO₂Bu-t	4-CH=CH2	-	
3-74	NHCO₂Bu-t	4-OMe	-	
3-75	NHCO ₂ Bu-t	4-OEt	-	

3-76	NHCO ₂ Bu-t	4-OCH ₂ CH ₂ OEt	-	
3-77	NHCO₂Bu-t	4-OPr-i	-	
3-78	NHCO₂Bu-t	4-OBu-n	-	
3-79	NHCO₂Bu-t	4-SMe	-	
3-80	NHCO₂Bu-t	4-SOMe	-	
3-81	NHCO₂Bu-t	4-SO₂Me	-	
3-82	NHCO₂Bu-t	4-NMe ₂	-	
3-83	NHCO₂Bu-t	4-N(Me)(CO ₂ Bu-t)	-	
3-84	NHCO₂Bu-t	5-CN	-	
3-85	NHCO₂Bu-t	4-CN	-	
3-86	NHCO₂Bu-t	4-morfolino	-	
3-87	NHCO₂Bu-t	5-Ph	-	
3-88	NHCO ₂ Bu-t	5-CO ₂ C ₂ H ₆	-	

[Tabla 39]

		[1 abia 39]		
Tabla 3 (cont	inuación)			<u> </u>
3-89	NHCO ₂ Bu-t	5-CONHCH ₃	-	
3-90	NHCO ₂ Bu-t	CF ₃	-	
3-91	NHCO ₂ Bu-t	5-OH	-	
3-92	NHCO₂Bu-t	5-SH	-	
3-93	NHCO₂Bu-t	4-CH ₂ CI=Cl ₂	-	
3-94	NHCO₂Bu-t	4-etinilo	-	
3-95	NHCO ₂ Bu-t	4-propargilo	-	
3-96	NHCO₂Bu-t	4-(3-yodo-2-propinilo)	-	
3-97	NHCO ₂ Bu-t	4-Ph	-	
3-98	NHCO₂Bu-t	4-C ₆ H ₄ OMe-4	-	
3-99	NHCO ₂ Bu-t	4-(2-piridilo)	-	
3-100	NHCO₂Bu-t	4-(4-CF ₃ -2-oxazolilo)	-	
3-101	NHCO₂Bu-t	4-(3-CF ₃ -5-Cl-2-piridilo)	-	
3-102	NHCO ₂ Bu-t	4-pirrolidino	-	
3-103	NHCO₂Bu-t	4-COMe	-	
3-104	NHCO₂Bu-t	4-CONHMe	-	
3-105	NHCO ₂ Bu-t	4-CONMe ₂	-	
3-106	NHCO ₂ Bu-t	4-COPr-c	-	
3-107	NHCO ₂ Bu-t	4-COPh	-	
3-108	NHCO ₂ Bu-t	4-COCH ₂ CH=CH ₂	-	
3-109	NHCO ₂ Bu-t	4-CO(propargilo)	-	
3-110	NHCO ₂ Bu-t	4-CO ₂ Me	-	
3-111	NHCO ₂ Bu-t	4-CO ₂ Ph	-	
3-112	NHCO ₂ Bu-t	4-CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	
3-113	NHCO ₂ Bu-t	4-CO ₂ (propargilo)	-	<u> </u>
3-114	NHCO ₂ Bu-t	4-Me	2-Cl	
3-115	NHCO₂Bu-t	4-Me	3-Cl	
3-116	NHCO ₂ Bu-t	4-Me	4-Cl	

[Tabla 40]

	,			
Tabla 3 (continuad	ción)			
3-117	NHCO₂Bu-t	4-Me	2,4-Cl ₂	
3-118	NHCO₂Bu-t	4-Me	3,5-Cl ₂	
3-119	NHCO₂Bu-t	4-Me	3,4,5-Cl ₃	
3-120	NHCO₂Bu-t	4-Me	2-Me	
3-121	NHCO₂Bu-t	3,4-diMe	-	
3-122	NHCO₂Bu-t	3,5-diMe	-	
3-123	NHCO ₂ Bu-t	4,5-diMe	-	
3-124	NHCO₂Bu-t	3,4,5-triMe	-	
3-125	NHCO₂Bu-t	3-Cl-4-Me	-	
3-126	NHCO₂Bu-t	5-Cl-4-Me	=	
3-127	NHCO₂Bu-t	3,5-diCl-4-Me	=	
3-128	NHCO₂Bu-t	3,5-diCl	-	
3-129	NHCO₂Bu-t	3,4-diCl	=	
3-130	NHCO₂Bu-t	3,4-diF	-	
3-131	NHCO₂Bu-n	4-NH ₂	-	
3-132	NHCO ₂ Bu-n	4-NHCO₂Bu-t	-	

3-133	NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	4-Me	-	
3-134	NHCO ₂ C ₂ F ₅	4-Me	-	
3-135	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ F	4-Me	-	
3-136	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ CF ₃	4-Me	-	
3-137	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	4-Me	-	
3-138	NHCO ₂ CH ₂ C ₂ F ₅	4-Me	-	
3-139	NHCO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	4-Me	-	
3-140	-NHCO ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	4-Me	-	
3-141	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ CH=CH ₂	4-Me	-	
3-142	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ CH=CHCH ₃	4-Me	-	
3-143	NHCO ₂ CH ₂ CH=CHCI	4-Me	-	
3-144	NHCO ₂ CH ₂ CH=CHCF ₃	4-Me	-	
3-145	NHCO ₂ CH ₂ CI=CI ₂	4-Me	-	

[Tabla 41]

Tabla 3 (continuación) 3-146 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-propinilo) 4-Me - 3-147 NHCO ₂ (2-butinilo) 4-Me - 3-148 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-butinilo) 4-Me - 3-149 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-pentinilo) 4-Me - 3-150 NHCO ₂ (1-propinilo) 4-Me - 3-151 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO ₂ (1,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO ₂ Pr-c 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et 4-Me - 3-156 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-159 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe) 4-Me - 3-160 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOPh
3-147 NHCO ₂ (2-butinilo) 4-Me - 3-148 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-butinilo) 4-Me - 3-149 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-pentinilo) 4-Me - 3-150 NHCO ₂ (1-propinilo) 4-Me - 3-151 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-pentinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ (4,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-154 NHCO ₂ Per-c 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-159 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂
3-148 NHCO2(1,1-dimetil-2-butinilo) 4-Me - 3-149 NHCO2(1,1-dimetil-2-pentinilo) 4-Me - 3-150 NHCO2(1-propinilo) 4-Me - 3-151 NHCO2(1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO2(1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO2(1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO2(1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-153 NHCO2(4,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-153 NHCO2Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO2Hex-c 4-Me - 3-155 NHCO2CH2CH2NHCO2Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO2CH2CH2NHCO2Et 4-Me - 3-157 NHCO2CH2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-158 NHCO2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 N
3-149 NHCO ₂ (1,1-dimetil-2-pentinilo) 4-Me - 3-150 NHCO ₂ (1-propinilo) 4-Me - 3-151 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO ₂ (4,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO ₂ Pex-c 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et 4-Me - 3-157 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-159 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COCH ₃ 4-Me - 3-160 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COPh 4-Me -
3-150 NHCO ₂ (1-propinilo) 4-Me - 3-151 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO ₂ (4,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO ₂ Hex-c 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et 4-Me - 3-157 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-159 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COCH ₃ 4-Me - 3-160 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COPh 4-Me -
3-151 NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-yodo-2-pentinilo) 4-Me - 3-152 NHCO ₂ (4,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO ₂ Hex-c 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et 4-Me - 3-157 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-159 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COCH ₃ 4-Me - 3-160 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COPh 4-Me -
3-152 NHCO ₂ (4,4,4-trifluoro-2-butinilo) 4-Me - 3-153 NHCO ₂ Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO ₂ Hex-c 4-Me - 3-155 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCO ₂ Et 4-Me - 3-157 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃ 4-Me - 3-158 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe ₂ 4-Me - 3-159 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COCH ₃ 4-Me - 3-160 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COPh 4-Me -
3-153 NHCO2Pr-c 4-Me - 3-154 NHCO2Hex-c 4-Me - 3-155 NHCO2CH2CH2NHCO2Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO2CH2CH2NHCO2Et 4-Me - 3-157 NHCO2CH2CH2CH2NHCOCH3 4-Me - 3-158 NHCO2CH2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2NI(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2NI(Me)COPh 4-Me -
3-154 NHCO2Hex-c 4-Me - 3-155 NHCO2CH2CH2NHCO2Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO2CH2CH2NHCO2Et 4-Me - 3-157 NHCO2CH2CH2CH2NHCOCH3 4-Me - 3-158 NHCO2CH2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2N(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2N(Me)COPh 4-Me -
3-155 NHCO2CH2CH2NHCO2Bu-t 4-Me - 3-156 NHCO2CH2CH2NHCO2Et 4-Me - 3-157 NHCO2CH2CH2CH2NHCOCH3 4-Me - 3-158 NHCO2CH2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2N(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2N(Me)COPh 4-Me -
3-156 NHCO2CH2CH2NHCO2Et 4-Me - 3-157 NHCO2CH2CH2NHCOCH3 4-Me - 3-158 NHCO2CH2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2N(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2N(Me)COPh 4-Me -
3-157 NHCO2CH2CH2NHCOCH3 4-Me - 3-158 NHCO2CH2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2NI(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2NI(Me)COPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2NI(Me)COPh 4-Me -
3-158 NHCO2CH2CH2NHMe2 4-Me - 3-159 NHCO2CH2CH2N(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2N(Me)COPh 4-Me -
3-159 NHCO2CH2CH2N(Me)COCH3 4-Me - 3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2N(Me)COPh 4-Me -
3-160 NHCO2CH2CH2NHCOPh 4-Me - 3-161 NHCO2CH2CH2N(Me)COPh 4-Me -
3-161 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ N(Me)COPh 4-Me -
3-162 NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ NHPh 4-Me -
3-163 NHCO ₂ (CH ₂) ₄ NH ₂ 4-Me -
3-164 NHCO ₂ CH ₂ NHCH ₂ Ph 4-Me -
3-165 NHCO ₂ CH ₂ N(CH ₂ Ph)(CO ₂ Bu-t) 4-Me -
3-166 NHCO ₂ CH ₂ C ₃ H ₅ -c 4-Me -
3-167 NHCO ₂ CH(CH ₃)C ₃ H ₅ -c 4-Me -
3-168 NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₁₁ -c 4-Me -
3-169 NHCO ₂ CH ₂ Ph 4-Me -
3-170 NHCO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Ph 4-Me -
3-171 NHCO ₂ CH(CH ₃)Ph 4-Me -

[Tabla 42]

Tabla 3 (continua	ción)			
3-172	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ Ph	4-Me	-	
3-173	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CF ₃ -4	4-Me	-	
3-174	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CN-4	4-Me	-	
3-175	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ CN-3	4-Me	-	
3-176	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Cl-4	4-Me	-	
3-177	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Cl-3	4-Me	-	
3-178	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ OMe-3	4-Me	-	
3-179	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ OMe-2	4-Me	-	
3-180	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Me-4	4-Me	-	
3-181	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Me-3	4-Me	-	
3-182	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Me-2	4-Me	-	
3-183	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ SO ₂ Me-4	4-Me	-	
3-184	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ SO ₂ Me-3	4-Me	-	
3-185	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Ph-4	4-Me	-	
3-186	NHCO ₂ CH ₂ C ₆ H ₄ Ph-3	4-Me	-	
3-187	NHCO ₂ CH ₂ Py-2	4-Me	-	•
3-188	NHCO ₂ CH ₂ (6-Me-2-Py)	4-Me	-	_
3-189	NHCO ₂ C(CH ₃) ₂ Py-4	4-Me	-	•

3-190	NHCO ₂ CH ₂ (2-tiazolilo)	4-Me	-	
3-191	NHCO ₂ CH ₂ (2-benztiazolilo)	4-Me	-	
3-192	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	4-Me	-	
3-193	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	4-Me	-	
3-194	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OPr-i	4-Me	-	
3-195	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OBu-i	4-Me	-	
3-196	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	4-Me	-	
3-197	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	4-i-Pr	-	
3-198	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₄ Cl-4	4-Me	-	
3-199	NHCOCH₂OPh	4-Me	-	
3-200	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ F-3	4-Me	-	
3-201	NHCOCH ₂ OC ₆ H ₄ OCF ₃ -3	4-Me	-	

[Tabla 43]

Tabla 3 (continuación)			
3-202	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Ph	4-Me	-	
3-203	NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Ph	4-Me	-	
3-204	NHCO ₂ (1,1-dimetil-3-fenil-2-pentinilo)	4-Me	-	
3-205	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SMe	4-Me	-	
3-206	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SCF ₃	4-Me	-	
3-207	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SPh	4-Me	-	
3-208	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOMe	4-Me	-	
3-209	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOCF ₃	4-Me	-	
3-210	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SOPh	4-Me	-	
3-211	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Me	4-Me	-	
3-212	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ CF ₃	4-Me	-	
3-213	NHCO ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ Ph	4-Me	-	
3-214	NHCO₂Ph	4-Me	-	
3-215	NHCO ₂ C ₆ H ₄ OMe-4	4-Me	-	
3-216	NHCONHMe	4-Me	-	
3-217	NHCONHC ₂ H ₅	4-Me	-	
3-218	NHCONHPr-n	4-Me	-	
3-219	NHCONHBu-t	4-Me	-	
3-220	NHCONHBu-s	4-Me	-	
3-221	NHCONH(Hex-n)	4-Me		

[Tabla 44] Tabla 3 (continuación) 5

Entre los compuestos representados en las Tablas 1 y 3, los datos espectrales (RMN 1 H (300 MHz, CDCl $_3$)) de algunos compuestos son como se representan en la Tabla 5.

10 [Tabla 71]

Tabla 5	
N°	Datos de RMN
1-3	1,24 (s, 9H), 4,01 (s, 3H), 4,37 (br-s, 2H), 5,21 (s, 2H), 6,41 (d, 1H, J = 1,1 Hz), 6,63 (d, 1H, J = 1,1 Hz),
	7,34-7,44 (m, 3H), 7,53-7,56 (m, 2H).
1-4	1,38 (t, 3H, J = 7,0 Hz), 3,97-4,04 (m, 2H), 4,01 (s, 3H), 4,35 (br-s, 2H), 5,16 (s, 2H), 5,88 (d, 1H, J = 2,0
	Hz), 6,20 (d, 1H, J = 2,0 Hz), 7,35-7,44 (m,3H), 7,52-7,55 (m, 2H).
1-5	2,19 (s, 3H), 3,96 (s, 3H), 4,29 (br-s, 2H), 5,27 (s, 2H), 6,42 (d, 1H, J = 8,2 Hz), 7,23-7,26 (m, 1H), 7,34-
	7,46 (m, 3H), 7,51-7,54 (m, 2H).
1-6	3,77 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 4,40 (br-s, 2H), 5,16 (s, 2H), 5,89 (s, 1H), 6,21 (s, 1H), 7,34-7,54 (m, 5H).
1-7	1,19 (t, 3H), 2,52 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 4,45 (br-s, 2H), 5,19 (s, 2H), 6,29 (s, 1H), 6,47 (s, 1H), 7,34-7,55
	(m, 5H).
1-17	1,33 (s, 9H), 3,85 (s, 3H), 3,99 (s, 3H), 5,20 (s, 2H), 6,54 (d, 1H, J = 2,1 Hz), 7,34-7,53 (m, 5H), 7,82 (d,
	1H, J = 2,1 Hz), 7,95 (br-s, 1H).
1-71	1,52 (s, 9H), 2,33 (s, 3H), 3,97 (s, 3H), 5,21 (s, 2H), 6,75 (s, 1H), 7,13 (br-s, 1H), 7,34-7,54 (m, 5H),
	7,71 (s, 1H).
1-73	1,53 (s, 9H), 3,98 (s, 3H), 5,24 (s, 2H), 5,48 (d, 1H, J = 11,1 Hz), 5,99 (d, 1H, J = 17,7 Hz), 6,65 (dd, 1H,
	J = 17,7, 11,1 Hz), 6,95 (s, 1H), 7,20 (br-s, 1H), 7,35-7,53 (m, 5H), 7,88 (s, 1H).
1-76	1,22 (t, 3H, J = 7,0 Hz), 1,51 (s, 9H), 3,58 (q, 2H, J = 7,0 Hz), 3,78 (t, 2H, J = 4,7 Hz), 3,98 (s, 3H), 4,18
	(t, 2H, J = 4,7 Hz), 5,17 (s, 2H), 6,52 (d, 1H, J = 2,2 Hz), 7,25 (br-s, 1H), 7,34-7,53 (m, 6H).
1-77	1,31 (d, 6H, J = 7,8 Hz), 1,51 (s, 9H), 3,98 (s, 3H), 4,66 (hept, 1H, J = 7,8 Hz), 5,17 (s, 2H), 6,42 (d, 1H,

	J = 1,8 Hz), 7,22 (br-s, 1H), 7,34-7,53 (m, 6H).
1-78	0,96 (t, 3H, J=7,2Hz), 1,41-1,48 (m, 2H), 1,52 (s, 9H), 1,71-1,80 (m, 2H), 3,98 (s, 3H), 4,03 (t, 2H, J =
	6,6 Hz), 5,19 (s, 2H), 6,47 (d, 1H, J = 1,8 Hz), 7,34-7,62 (m, 7H).
1-82	1,51 (s, 9H), 3,00 (s, 6H), 3,98 (s, 3H), 5,16 (s, 2H), 6,15 (d, 1H), 7,02 (brs, 1H), 7,11 (d, 1H), 7,37-7,44
	(m, 3H), 7,52-7,55 (m, 2H).
1-83	1,49 (s, 9H), 1,52 (s, 9H), 3,30 (s, 3H), 4,01 (s, 3H), 5,21 (s, 2H), 7,12 (d, 1H, J = 1,9 Hz), 7,14 (br-s,
	1H), 7,35-7,55 (m, 5H), 7,80 (d, 1H, J = 1,9 Hz).
1-86	1,51 (s, 9H), 3,31 (t, 4H, J = 4,9 Hz), 3,81 (t, 4H, J = 4,9 Hz), 3,99 (s, 3H), 5,17 (s, 2H), 6,30 (d, 1H, J =
	2,2 Hz), 7,16 (br-s, 1H), 7,32-7,65 (m, 6H).
1-89	1,53 (s, 9H), 3,87 (s, 3H), 4,03 (s, 3H), 5,70 (s, 2H), 7,34-7,55 (m, 5H), 7,77 (br-s, 1H), 7,93 (d, 1H),
	8,21 (d, 1H).
1-90	1,54 (s, 9H), 3,99 (s, 3H), 5,28 (s, 2H), 7,15 (s, 1H), 7,35-7,51 (m, 6H), 8,18 (s, 1H).

[Tabla 72]

Tabla 5 (c	continuación)
1-131	0,95 (t, 3H, J=7,3Hz), 1,37-1,44 (m, 2H), 1,60-1,70(m,2H),3,99(s,3H),4,16(t,2H,J=6,7Hz),4,25 (br-s, 2H),
	5,14(s, 2H), 6,18(d, 1H, J=2,0Hz), 7,16(d, 1H, J=2,0Hz), 7,35-7,47 (m, 3H), 7,51-7,54 (m, 2H).
1-132	0,95 (t, 3H, J=7,4Hz), 1,41 (tq, 2H, J=7,6, 7,4Hz), 1,51 o 1,55 (s, 9H), 1,66 (tt, 2H, J=7,6, 6,7Hz), 4,03
	(s, 3H), 4,18 (t, 2H, J=6,7Hz), 5,20 (s, 2H), 6,72 (br-s, 1H), 7,20 (br-s, 1H), 7,35-7,54 (m, 5H), 7,78 (d,
	1H, J=1,8Hz).
1-197	1,23 (t, 3H), 1,24 (d, 6H), 2,90 (septete, 1H), 3,55 (q, 2H), 3,69(t, 2H), 3,99 (s, 3H), 4,34 (t, 2H), 5,23 (s,
	2H), 6,82 (s, 1H), 7,35-7,54 (m, 6H), 7,79 (s, 1H).

[Tabla 73]

10

5 Tabla 5 (continuación)

Cada uno de los derivados de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1) o sus sales (en adelante denominados como el "compuesto de la presente invención") presenta actividad fúngica excelente frente a un amplio intervalo de hongos que pertenecen, por ejemplo, a oomicetos, ascomicetos, deuteromicetos y basidiomicetos. Por lo tanto, la composición que contiene el compuesto de la presente invención como el principio activo se puede usar para controlar diversas enfermedades de plantas que infestan sobre cultivos agrícolas u hortícolas, incluyendo flores ornamentales, pastos y cultivos forrajeros, por medio del tratamiento de semillas, aplicación al follaje, aplicación al suelo, o aplicación a la superficie mediante agua.

Por ejemplo, es posible usar la composición que contiene el compuesto de la presente invención para controlar enfermedades de plantas mostradas a continuación.

Remolacha azucarera: Cercosporiosis (Cercospora beticola)

Podredumbre de la raíz por Aphanomyces (Aphanomyces cochlioides)

Cacahuete: Mancha marrón de la hoja (Mycosphaerella arachidis)

Manchas de la hoja (Mycosphaerella berkeleyi)

Pepino: Oídio (Sphaerotheca fuliginea)

Tizón gomoso del tallo (Mycosphaerella melonis) Podredumbre del tallo (Sclerotinia sclerotiorum)

Moho gris (Botrytis cinerea)

Sarna (Cladosporium cucumerinum)

Mildiú aterciopelado (Pseudoperonospora cubensis)

Tomate: Moho gris (Botrytis cinerea)

Moho de la hoja (Cladosporium fulvum)

Quemadura algodonosa (Pythium aphanidermatum)

Tizón tardío (Phytophtora infestans)

Berenjena: Moho gris (Botrytis cinerea)

Pie negro (Corynespora melongeneae)

Oídio (Erysiphe cichoracearum)

Espinaca Enfermedad de los semilleros (Pythium ultimum)

Fresa:

Moho gris (Botrytis cinerea)

Oídio (Sphaerotheca aphanis)

Cebolla: Podredumbre del cuello por moho gris (Botrytis allii)

Moho gris (Botrytis cinerea)

Alubias

Podredumbre del tallo (Sclerotinia sclerotiorum)

Moho gris (Botrytis cinerea)

Manzana: Oídio (Podosphaera leucotricha)

Sarna (Venturia inaequalis)

	Tizón de las flores (Monilinia mali)
Caqui:	
	Oídio (Phillactinia kakicola)
	Antracnosis (Gloeosporium kaki)
	Mancha foliar angular (Cercospora kaki)
Melocotón y cereza:	
	Podredumbre marrón (Monilinia fructicola)
Uva:	Moho gris (Botrytis cinerea)
	Oídio (Uncinula necator)
	Podredumbre amarga (Glomerella cingulata)
	Mildiú aterciopelado (Plasmopara viticola)
Pera:	Sarna (Venturia nashicola)
	Roya (Gymnosporangium asiaticum)
	Mancha negra (Alternaria kikuchiana)
Té:	Tizón gris (Pestalotia theae)
	Antracnosis (Colletotrichum theae-sinensis)
Cítrico:	Sarna (Elsinoe fawcetti)
	Moho azul (Penicillium italicum)
	Moho verde común (Penicillium digitatum)
	Moho gris (Botrytis cinerea)
Cebada:	Oídio (Erysiphe graminis f.sp. hordei)
ocbada.	Carbón desnudo (Ustilago nuda)
Trigo:	Sarna (Gibberella zeae)
riigo.	Roya de la hoja (Puccinia recondita)
	Mancha borrosa (Cochliobolus sativus)
	Mancha de la gluma (Leptosophaeria nodorum)
	Mancha ocular (Pseudocercosporella herpotrichoides)
	Oídio (Erysiphe graminis f.sp.tritici)
	Moho níveo (Micronectriella nivalis)
	Podredumbre parduzca de la raíz (Pythium iwayamai)
Arroz:	
AITOZ.	Piriculariosis (Pyricularia oryzae)
	Tizón de la vaina (Rhizoctonia solani)
	Enfermedad bakanae (Gibberella fujikuroi)
	Mancha marrón (Cochliobolus miyabeanus)
Caia	Tizón de la semilla (Pythium graminicolum)
Soja:	Mancha púrpura de la semilla (Cercospora kikuchii)
	Mildiú aterciopelado (Peronospora manshurica)
Datata	Podredumbre de la raíz por Phytophtora (Phytophtora sojae)
Patata:	Tizón tardío (Phytophtora infestans)
Plantas crucíferas:	
	Hernia de la col (Plasmodiophora brassicae)
Tabaco:	Podredumbre del tallo (Sclerotinia sclerotiorum)
	Oídio (Erysiphe cichoracearum)
Tulipán:	Moho gris (Botrytis cinerea)
Agrostis:	Tizón níveo por Sclerotinia (Sclerotinia borealis)
_	Tizón rojo de Pythium (Pythium aphanidermatum)
Pasto ovillo:	
	Oídio (Erysiphe graminis)

10

5

Por ejemplo, los compuestos de la presente invención también son eficaces frente a esas cepas resistentes de hongos para tizón tardío de la patata y del tomate (Phytophthora infestans), mildiu aterciopelado de las cucurbitáceas (Pseudoperonospora cubensis) y mildiu aterciopelado de la uva (Plasmopara viticola), que muestran resistencia a metalaxilo, así como las susceptibles.

plantas. Por lo tanto, se desea un fungicida eficaz que pueda controlar tales hongos que son resistentes frente a esas enfermedades problemáticas de las plantas. Los compuestos de la presente invención son eficaces para esas

cepas resistentes de hongos frente a fungicidas mencionados anteriormente, así como las susceptibles.

15

Además, los compuestos de la presente invención también son eficaces frente al mildiu aterciopelado de las cucurbitáceas (Pseudoperonospora cubensis) y mildiu aterciopelado de la uva (Plasmopara viticola) que muestran

resistencia a fungicidas estrobilurínicos (por ejemplo, cresoxim-metilo, azoxistrobina, etc.), como también a hongos susceptibles.

- Los ejemplos de lesión preferida de plantas a la que se aplican los compuestos de la presente invención incluyen diversas lesiones de plantas provocadas por oomicetos tales como mildiu aterciopelado de la uva (Plasmopara viticola), mildiu aterciopelado de calabazas (Pseudoperonospora cubensis), tizón tardío de la patata y del tomate (Phytophthora infestans), enfermedad del césped por Pythium (Pythium aphanidermatum, etc.) y pie negro de la remolacha (Aphanomyces cochlioides).
- Además, los compuestos de la presente invención se pueden usar también como agente antiensuciamiento, que evita que los organismos que residen en el agua se adhieran a estructuras colocadas en agua, tales como el fondo exterior de una embarcación y la red de pesca.
- Además, los compuestos químicos intermedios de los compuestos químicos de la presente invención pueden tener actividades fungicidas.

También, los compuestos de la presente invención pueden estar contenidos en pinturas y fibras, y de ese modo se pueden usar como un agente antimicrobiano y antifúngico para paredes, bañeras, zapatos y tejidos.

20 2) Agente de control de una enfermedad de las plantas

35

40

50

- El segundo aspecto de la presente invención se refiere a un agente de control de una enfermedad de las plantas que contiene el compuesto de la presente invención como principio activo.
- El agente de control de una enfermedad de las plantas de la presente invención se puede usar en el estado de los compuestos de la presente invención solo sin la adición de otros ingredientes, o, para el uso de sustancias químicas agrícolas, el compuesto se puede aplicar en forma de formulaciones generales para sustancias químicas agrícolas, tales como polvos humectables, gránulos, polvos, concentrados emulsionables, disoluciones acuosas, suspensiones y suspensiones concentradas.

Para los aditivos y portadores que se deben utilizar en el agente de control de una enfermedad de las plantas de la presente invención, se pueden usar polvos vegetales tales como polvo de soja y polvo de trigo, polvos finos minerales tales como tierra de diatomeas, apatita, yeso, talco, bentonita, pirofilita y arcilla, y compuestos orgánicos e inorgánicos tales como benzoato de sodio, urea, y torta de sal, cuando los compuestos se formulan en formulaciones sólidas.

Cuando los compuestos se formulan en formulaciones líquidas, se pueden usar como disolvente las fracciones de petróleo tales como queroseno, xileno y nafta disolvente, ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, alcohol, acetona, tricloroetileno, metilisobutilcetona, aceite mineral, aceite vegetal y agua.

- En el agente de control de una enfermedad de las plantas de la presente invención, se pueden añadir tensioactivos a las formulaciones, a fin de hacer homogéneas y estables a las formulaciones, si es apropiado.
- Los ejemplos de los tensioactivos incluyen tensioactivos no iónicos tales como alquil fenil éter añadido con polioxietileno, alquil éter añadido con polioxietileno, éster de ácido graso superior añadido con polioxietileno, éster de ácido graso superior con sorbitán añadido con polioxietileno, triestirilfenil éter añadido con polioxietileno; sal de éster sulfúrico de alquil fenil éter añadido con polioxietileno, sal de alquilbencenosulfonato, sal de éster sulfúrico de alcohol superior, sal de alquilnaftalenosulfonato, sal de policarboxilato, sal de lignosulfonato, condensado con formaldehído de alquilnaftalenosulfonato, y copolímero de isobutileno-anhídrido maleico.
 - En general, el contenido de un principio activo en las formulaciones está en un intervalo de 0,5 a 95% en peso, y preferiblemente de 2 a 70% en peso, basado en el peso total de la composición (formulación).
- Cuando el agente de control de una enfermedad de las plantas de la presente invención está en forma de polvos humectables, concentrados emulsionables y formulaciones de suspensiones concentradas, se puede aplicar en una forma preparada diluyendo las formulaciones con agua hasta la suspensión o la emulsión a concentraciones deseadas, mientras que los polvos y los gránulos del mencionado compuesto se pueden dispersar directamente en las plantas.
- No es necesario mencionar que el compuesto de la presente invención o el agente de control de una enfermedad de las plantas de la presente invención solo tiene actividad fungicida suficiente; sin embargo, se puede usar en combinación con un tipo, dos tipos, o más de varios tipos de fungicidas, insecticidas, acaricidas y sinérgicos.
- Los ejemplos típicos para los fungicidas, insecticidas, acaricidas y reguladores del crecimiento de las plantas, aquellos que son utilizables en mezcla con los compuestos de la presente invención o con el agente de control de una enfermedad de las plantas de la presente invención se muestran a continuación.

Fungicidas: Agentes de cobre: cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico 5 Agentes de azufre: tiuram, zineb, maneb, mancozeb, ziram, propineb, policarbamato, etc. Agentes de polihaloalquiltio: captano, folpet, diclorofluanida, etc. Agentes de cloro orgánico: clorotalonilo, ftalida, etc. 10 Agentes de fósforo orgánico: IBP, EDDP, triclofosmetilo, pirazofós, fosetilo, etc. Agentes de bencimidazol: tiofanato-metilo, benomilo, carbendazim, tiabendazol, etc. 15 Agentes de dicarboxiimida: iprodiona, procimidona, vinclozolina, fluoroimida, etc. Agentes de carboxiamida: oxicarboxina, mepronilo, flutolanilo, tecloftalam, triclamida, pencicurón, etc. Agentes de acilalanina: metalaxilo, oxadixilo, furalaxilo, etc. 20 Agentes a base de estrobilurina: azoxistrobina, kresoxim-metilo, piraclostrobina, trifloxistrobina, piribencarb, famoxadona, fenamidona, etc. Agentes de anilinopirimidina: andoprina, mepanipirim, pirimetanilo, diprozinilo, etc. 25 Agentes SBI: triadimerón, triadimenol, bitertanol, miclobutanilo, hexaconazol, propiconazol, triflumizol, procloraz, pefurazoato, fenarimol, pirifenox, triforina, flusilazol, etaconazol, diclobutorazol, fluotrimazol, flutriafeno, penconazol, diniconazol, imazalilo, tridemorf, fenpropimorf, butiobato, epoxiconazol, metoconazol, protioconazol, espiroxamina, fenhexamida, piributicarb, etc. 30 antibióticos: polioxinas, blasticidina-S, kasugamicina, validamicina. sulfato de Agentes dihidroestreptomicina, etc. Agentes a base de anilida: boscalida, pentiopirad, fluopiram, bixafeno, etc. 35 Agentes a base de guanidina: sal de acetato de iminoctadina, sal de albesilato de iminoctadina, dodina, guazatina, etc. Agentes a base de valina: dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, bentiavalicarb, mandipropamida, etc. 40 Otros: cimoxanilo, ciazofamida, amisulbrom, propamocarb, fluazinam, sal de acetato de propamocarb, etaboxam, fluopicolida, zoxamida, ciflufenamida, metrafenona, proquinazida, hidroxi isoxazol, metasulfocarb, anilazina, isoprotiolano, ferimzona, probenazol, tiadinilo, acibenzolar s-metilo, isotianilo, piroquilona, ftalida, triciclazol, carpropamida, fenoxanilo, diclocimet, fluazinam, fludioxonilo, pirrolenitrina, hidroxil isoxazol, flusulfamida, dietofencarb, quintozeno, metasulfocarb, anilazina, quinometionato, ditianón, 45 dinocap, diclomezina, ácido oxolínico, lecitina, bicarbonato de sodio, fenaminosulf, óxido de fenazina, etc. Insecticidas/Acaricidas: 50 Insecticidas a base de fósforo orgánico y de carbamatos: fentión, fenitrotión, diazinón, clorpirifos, ESP, vamidotión, fentoato, dimetoato, formotión, malatión, triclorfón, tiometón, fosmet, diclorvós, acefato, EPBP, metil paratión, oxidometón-metilo, etión, salitión, cianofós, isoxatión, piridafentión, fosalona, metidatión, sulprofós, clorfenvinfós, tetraclorvinfós, dimetilvinfós, propafós, isofenfós, etiltiometón, profenofós, piraclofós, monocrotofós, azinfós-metillo, aldicarb, metomillo, tiodicarb, carbofurán, carbosulfán, benfuracarb, 55 furatiocarb, propoxur, BPMC, MTMC, MIPC, carbarilo, pirimicarb, etiofencarb, fenoxicarb, etc. Insecticidas a base de piretroides: permetrina, cipermetrina, deltametrina, fenvalerato, fenpropatrina, piretrinas, aletrina, tetrametrina, resmetrina, dimetrina, propatrina, fenotrina, protrina, fluvalinato, ciflutrina, cihalotrina, flucitrinato, etofenprox, cicloprotrina, tralometrina, silafluofeno, Halfenprox, acrinatrina, etc.

patógenos de insectos y otras sustancias agrícolas microbianas, etc.

Insecticidas a base de benzoilurea y otros insecticidas: diflubenzurón, clorfluazurón, hexaflumurón, triflumurón, tetrabenzurón, flufenoxurón, flucicloxurón, buprofezina, piriproxifeno, metopreno, benzoepina, diafentiurón, acetamiprida, imidacloprida, nitenpiram, fipronilo, cartap, tiociclam, bensultap, sulfato de nicotina, rotenona, metaldehído, emamectina, flubendiamida, espinosad, aceite de máquina, BT, virus

60

Nematocidas: fenamifós, fostiazato, etc.

Acaricidas: clorobenzilato, fenisobromolato, dicofol, amitraz, BPPS, benzomato, hexatiazox, óxido de fenbutatina, polinactina, quinometionato, CPCBS, tetradifón, abamectina, milbemectina, clofentezina, cihexatina, piridabeno, fenpiroximato, tebufenpirad, pirimidifeno, fenotiocarb, dienoclor, fluacripirim, etc.

Reguladores del crecimiento de las plantas: giberelinas (por ejemplo, giberelina A3, giberelina A4, giberelina A7, etc.), IAA, NAA, etc.

Eiemplos

5

10

La presente invención se explicará con mayor detalle a partir de los ejemplos, pero la presente invención no se debería interpretar como limitada a estos ejemplos.

15 (Ejemplo de Preparación)

(Etapa 1)

Una mezcla de 2,94 g (11,4 mmoles) de 4-cloro-2,6-piridin-dicarboxilato de dietilo y 20 ml de etanol se calentó hasta 55°C, y se añadió gota a gota a la mezcla durante 8 horas una disolución acuosa preparada a partir de 0,27 g (6,8 mmoles) de hidróxido de sodio y 50 ml de agua. Tras terminar la adición gota a gota, la disolución mixta se agitó durante una hora y se dejó reposar toda la noche a temperatura ambiente. Después de que el disolvente se eliminó a presión reducida, el residuo se volvió a extraer con agua/acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y las capas acuosas se combinaron. Después se añadió ácido clorhídrico concentrado a la capa acuosa, ajustando de ese modo el pH a 2,5. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo, se lavó con salmuera saturada, y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó a presión reducida para obtener 1,42 g (6,2 mmoles, rendimiento de 54%) de 4-cloro-2,6-piridin-dicarboxilato de monoetilo.

(Etapa 2)

30

55

60

65

A una mezcla de 1,42 g (6,2 mmoles) de 4-cloro-2,6-piridin-dicarboxilato de monoetilo, 12 ml de tetrahidrofurano anhidro y 0,69 g (6,8 mmoles) de trietilamina, se le añadieron 1,87 g (6,8 mmoles) de difenil fosforil azida a temperatura ambiente, seguido de calentamiento 60°C y agitación adicional durante una hora.

A la mezcla de la reacción se le añadieron 0,93 g (12,6 mmoles) de t-butanol, seguido de agitación adicional a 60°C durante 18 horas. La disolución de la reacción se añadió a agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después el disolvente se eliminó a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 5/1 (v/v)) para obtener 1,00 g (3,3 mmoles, rendimiento de 54%) de 2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloropicolinato de etilo.

(Etapa 3)

A una mezcla de 1,00 g (3,3 mmoles) de 2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloropicolinato de etilo y 20 ml de etanol anhidro, se le añadieron 0,38 g (10,0 mmoles) de borohidruro de sodio, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 17 horas. A la disolución de la reacción se le añadió ácido clorhídrico diluido, ajustando de ese modo el pH a 2, y la disolución se neutralizó añadiendo disolución acuosa de bicarbonato de sodio saturado. Después de que el etanol se eliminó a presión reducida, el resultante se extrajo con acetato de etilo y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó a presión reducida, y el residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 3/1 (v/v)) para obtener 0,75 g (2,9 mmoles, rendimiento de 87%) de 2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloro-6-hidroximetilpiridina.

A una mezcla de 0,74 g (2,9 mmoles) de 2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloro-6-hidroximetilpiridina y 20 ml de diclorometano 20 ml, se le añadieron 0,29 g (3,7 mmoles) de piridina, y posteriormente se añadieron 0,41 g (3,5 mmoles) de cloruro de tionilo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3,5 horas. La disolución de la reacción se añadió a agua, y se añadió una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, ajustando de ese modo el pH a 6, seguido de extracción con cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se eliminó a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 9/1 (v/v)) para obtener 0,56 g (2,0 mmoles, rendimiento de 71%) de 2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloro-6-clorometilpiridina.

(Etapa 5)

Una mezcla de 5 ml de N,N-dimetilformamida seca y 0,12 g (0,6 mmoles) de oxima de (Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenilmetanona se enfrió en un baño de hielo, y se añadieron 0,03 g (60% en aceite, 0,75 mmoles) de hidruro de

sodio a la disolución. Después de que la suspensión se agitó durante 5 minutos, se añadió una mezcla de 0,19 g (0,69 mmoles) de 2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloro-6-clorometilpiridina y 5 ml de N,N-dimetilformamida, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3 horas.

La mezcla de reacción se añadió a una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio, y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se eliminó a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 4/1 (v/v)) para obtener 0,16 g (0,3 mmoles, rendimiento de 62%) de O-[2-(t-butoxicarbonil)amino-4-cloropiridin-6-ilmetil]-oxima de la (Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)fenilmetanona (compuesto de un número de compuesto 1-275 en la Tabla 1)

Aunque se muestran a continuación varios ejemplos de formulación del agente de control una enfermedad de las plantas de la presente invención, los aditivos y la relación de aditivos no se deberían de limitar a ellos, y se pueden cambiar ampliamente. Las partes representadas en los ejemplos de formulación están en peso.

Ejemplo 1 de formulación: Polvos humectables

Compuesto de la presente invención	40 partes
Arcilla	53 partes
Dioctilsulfosuccinato de sodio	4 partes
Lignosulfonato de sodio	3 partes

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se muelen finamente para obtener polvos humectables que contienen 40% de un principio activo.

Ejemplo 2 de formulación: Concentrados emulsionables

2	5
_	J

15

Compuesto de la presente invención	10 partes
Sorbesso 200	53 partes
Ciclohexanona	26 partes
Dodecilbencenosulfonato de calcio	1 parte
Polioxietilen alquil alil éter	10 partes
Polioxietilen alquil alil éter	10 partes

Los componentes anteriores se mezclan y se disuelven para obtener concentrados emulsionables que contienen 10% de un principio activo.

30

35

Ejemplo 3 de formulación: Polvos

Compuesto de la presente invención	10 partes
Arcilla	90 partes
Alcilla	30 partes

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se muelen finamente para obtener polvos que contienen 10% de un principio activo.

Ejemplo 4 de formulación: Gránulos

Compuesto de la presente invención	5 partes
Arcilla	73 partes
Bentonita	20 partes
Dioctilsulfosuccinato de sodio	1 parte
Fosfato de potasio	1 parte

40 Los componentes anteriores se muelen bien y se mezclan, se amasan bien con agua, se granulan y después se secan para obtener gránulos que contienen 5% de un principio activo.

Ejemplo 5 de formulación: Suspensiones

Compuesto de la presente invención	10 partes
Polioxietilen alquil alil éter	4 partes
Policarboxilato de sodio	2 partes
Glicerina	10 partes
Goma xantana	0,2 parte
Agua	73.8 partes

Los componentes anteriores se mezclan, y se muelen mediante molienda en húmedo hasta un tamaño de partículas de 3 micrómetros o menos para obtener suspensiones que contienen 10% de un principio activo.

5 Ejemplo 6 de formulación: Polvos humectables granulares

Compuesto de la presente invención 40 partes Arcilla 36 partes Cloruro de potasio 10 partes 1 parte Alquilbencenosulfonato de sodio Lignosulfonato de sodio 8 partes Condensado de alquilbencenosulfonato de 5 partes sodio con formaldehído

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se muelen finamente y después se amasan con una cantidad apropiada de agua para formar una sustancia similar a arcilla. La sustancia similar a arcilla se granula y después se seca para obtener polvos humectables granulares que contienen 40% de un principio activo.

(Ejemplo de ensayo) ensayo de control de tizón tardío del tomate

Se pulverizó un concentrado emulsionable del ejemplo 2 de formulación sobre la plántula de tomate (variedad de cultivo: "Regina", etapa de 4-5 hojas) que se hizo crecer en una maceta no acristalada, a la concentración de un principio activo de 100 ppm. Tras la pulverización, la plántula de tomate se secó al aire a temperatura ambiente y se inoculó por pulverización una suspensión de zoosporangios de fitoftora (Phytophthora infestans), y después la plántula de tomate se retuvo en una cámara termostática con alta humedad (20°C) mantenida en un estado de luz u oscuridad cada 12 horas durante 4 días. Se examinó el estado del aspecto de las lesiones en las hojas, y se comparó con la plántula de tomate sin tratar, y de este modo se determinó el efecto del control. Como resultado, los compuestos mostrados más abajo exhibieron un valor preventivo de 80%. Los números de los compuestos corresponden a los números de los compuestos en la Tabla 1.

Número de compuestos: 1-17, 1-68 a 1-82, 1-84 a 1-87, 1-131, y 1-197.

Aplicabilidad industrial

10

25

30

La presente invención proporciona un derivado de tetrazoiloxima o una sal del mismo, que es excelente en un efecto de control frente a la lesión por una enfermedad de las plantas, y un agente de control de enfermedades de las plantas que contiene el mismo como principio activo, y por lo tanto es industrialmente bastante útil.

REIVINDICACIONES

1. Derivado de tetrazoiloxima representado por la fórmula (1):

$$A \longrightarrow (X)_{n1}$$

5

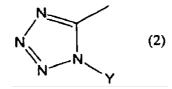
en la que X representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C_{1-8} , un grupo alcoxi de C_{1-8} , un grupo ciano, un grupo alquil C_{1-8} -sulfonilo, un grupo nitro, un grupo haloalquilo de C_{1-8} , o un grupo arilo sustituido o no sustituido;

10 n1 representa cualquiera de los números enteros de 0 a 5, y

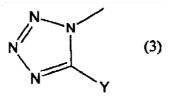
cuando n1 es 2 o más, X(s) puede ser igual o diferente entre sí;

A representa un grupo tetrazoílo representado por la fórmula (2):

15



(en la que Y representa un grupo alquilo de C₁₋₈), o un grupo tetrazoílo representado por la fórmula (3):

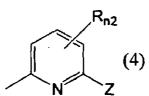


20

(en la que Y es igual a como se define anteriormente); y

Het representa un grupo piridilo representado por la fórmula (4):

25



30

(en la que por lo menos un R representa un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo formilo, un grupo carboxilo, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1-8} no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de C_{2-8} no sustituido, un grupo alquinilo de C_{2-8} no sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, OR^1 , $S(O)_mR^1$, COR^1 , o CO_2R^1 ,

35

 R^1 representa un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C_{1-8} no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de C_{2-8} no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de C_{2-8} no sustituido o sustituido, un grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo arilo no sustituido,

m representa cualquiera de los números enteros de 0 a 2,

n2 representa cualquiera de los números enteros de 1 a 3, y

25

cuando n2 es 2 o más, varios R(s) pueden ser iguales o diferentes entre sí,

- 5 y, Z representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino, o un grupo representado por la fórmula: Q³C(=O)NH- (en la que Q³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁₋₈, un grupo haloalquilo de C₁₋₈, un grupo alquenilo de C₂₋₈, un grupo haloalquenilo de C₂₋₈, un grupo alquinilo de C₂₋₈, un grupo haloalquinilo de C₂₋₈, un grupo alcoxi de C_{1-8} , un grupo haloalcoxi de C_{1-8} , un grupo alquenil C_{2-8} -oxi, un grupo haloalquenil C_{2-8} -oxi, un grupo alquinil C_{2-8} -oxi, un grupo haloalquinil C2-8-oxi, un grupo cicloalquilo de C3-8, un grupo cicloalquil C3-8-oxi, un grupo alquilamino de C1-10 8, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo cicloalquilo de C₃₋₈, un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi de C₁₋₈ no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo aralquiloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C₂₋₈-oxi sustituido con un 15 grupo arilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C_{1.8} sustituido con un grupo ariltio sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi de C_{1.8} sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfinilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-sulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi de C₁₋₈ sustituido con un grupo arilsulfonilo no sustituido o sustituido, un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo carboxilo, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido 20 con un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo ariloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alquil C₁₋₈-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo alcoxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo sustituido con un grupo acilo, o un grupo alquilo de C₁₋₈ sustituido con un grupo heterociclicoxi no sustituido o sustituido), y una sal del mismo.
 - 2. Derivado de tetrazoiloxima según la reivindicación 1, en el que Y es un grupo metilo, y una sal del mismo.
 - 3. Agente de control de enfermedades de las plantas que comprende el derivado de tetrazoiloxima según la reivindicación 1 o 2 o una sal del mismo como un principio activo.