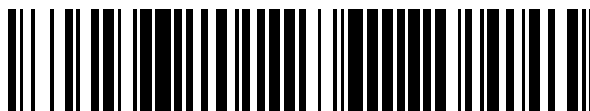


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 553 417**

51 Int. Cl.:

A01N 43/08	(2006.01)	A01N 43/84	(2006.01)
A01N 43/10	(2006.01)	C07D 213/26	(2006.01)
A01N 43/36	(2006.01)	C07D 213/50	(2006.01)
A01N 43/40	(2006.01)	C07D 213/61	(2006.01)
A01N 43/42	(2006.01)	C07D 213/64	(2006.01)
A01N 43/60	(2006.01)		
A01N 43/64	(2006.01)		
A01N 43/78	(2006.01)		
A01N 43/80	(2006.01)		
A01N 43/82	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.12.2009 E 09765114 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **16.09.2015 EP 2375898**

54 Título: **Nuevos herbicidas**

30 Prioridad:

15.12.2008 GB 0822834

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

09.12.2015

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (50.0%)
Schwarzwaldallee 215
4058 Basel, CH y
SYNGENTA LIMITED (50.0%)**

72 Inventor/es:

**TAYLOR, JOHN BENJAMIN;
WAILES, JEFFREY STEVEN;
JEANMART, STEPHANE ANDRÉ MARIE y
GOVENKAR, MANGALA**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

Observaciones :

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

ES 2 553 417 T3

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

DESCRIPCIÓN

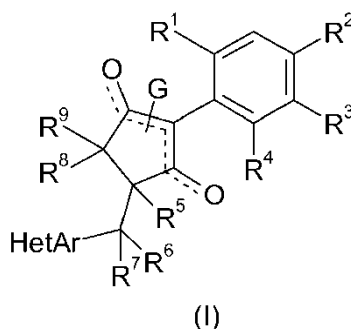
Nuevos herbicidas

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

Los compuestos ciclopentanodiónicos que tienen acción herbicida se describen, por ejemplo, en los documentos WO 01/74770 y WO 96/03366.

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

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



en la que

G es hidrógeno o un metal agrícolamente aceptable, sulfonio, amonio o grupo protector,

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

R² y R³ son, cada uno independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂, haloalcoxi de C₁-C₂, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido,

y en la que, en R² y R³, cuando están presentes, los susituyentes opcionales en el arilo se seleccionan, independientemente, de: halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo (C₁-C₆), alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), cicloalqueno de C₅-7 (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, alcoxi de C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), tri-alquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi de C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi de C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆), cicloalquil C₃-C₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), alqueno C₃-C₁₀-oxi, alquino C₃-C₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀-tio, haloalquil C₁-C₁₀-tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio, cicloalquil C₃-C₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)-silil-alquil (C₁-C₆)tio, ariltio, alquil C₁-C₆-sulfonio, haloalquil C₁-C₆-sulfonio, alquil C₁-C₆-sulfino, haloalquil C₁-C₆-sulfino, arilsulfonio, tri-alquil (C₁-C₄)sililo, arildi-alquil (C₁-C₄)sililo, alquil C₁-C₄-diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁-C₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi de C₁-C₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi C₁-C₃)-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-carboniloxi, arilcarboniloxi, di-alquil (C₁-C₆)-aminocarboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil (C₁-C₆)-amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino, o arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆);

o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico se ciclan para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 5, 6 o 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆;

y en la que, en R² y R³, cuando están presentes, el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfino o alquil C₁-C₃-sulfonio;

R⁴ es metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂,

5 R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquenoil de C₃-C₆-oxi, haloalquenoil C₃-C₆-oxi, alquenoil C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi de C₁-C₆-sulfonilo, haloalcoxi de C₁-C₆-sulfonilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o

10 R⁶ y R⁷ o R⁸ y R⁹, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico opcionalmente sustituido o un heterociclilo opcionalmente sustituido, o R⁵ y R⁶ forman juntos un enlace, y

HetAr es un heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo;

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

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

R^a es H, alquilo de C₁-C₁₈, alquenoil de C₂-C₁₈, alquenoil de C₂-C₁₈, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)-amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆-sillil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenoil de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

35 R^b es alquilo de C₁-C₁₈, alquenoil de C₃-C₁₈, alquenoil de C₃-C₁₈, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)-amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆-sillil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenoil de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

55 R^c y R^d son, cada uno independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₁₀, alquenoil de C₃-C₁₀, alquenoil de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi de C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₂-C₅)-aminoalquilo, trialquil C₃-C₆-sillil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que

5 C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆-silil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxi(C₁-C₅)alquilo (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi(C₁-C₅)alquilo (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo, o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; y

en los que "arilo" significa fenilo;

en los que "heteroarilo" significa un anillo heteroarilo de 6 miembros que está opcionalmente benzanillado; y

en los que "heterociclilo" significa un sistema anular monocíclico o bicíclico no aromático que contiene hasta 7 átomos, incluyendo uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N.

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

25 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto alquilo (solo o como parte de un grupo más grande, tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, cicloalquilo de C₃-C₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo de C₅-C₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₄ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, alcoxi de C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), tri-alquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi de C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi de C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-C₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), alquenil C₃-C₁₀-oxi, alquinil C₃-C₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀-tio, haloalquil C₁-C₁₀-tio, aril-alquil (C₁-C₄)-tio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-C₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), tri-alquil (C₁-C₄)silil-alquil (C₁-C₆)-tio, ariltio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, arilsulfonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), tri-alquil (C₁-C₄)-sililo, arildi-alquil (C₁-C₄)-sililo, alquil (C₁-C₄)-diarilsililo, triarilsililo, aril-alquil (C₁-C₄)-tio-alquilo (C₁-C₄), ariloxi-alquilo (C₁-C₄), formilo, alquil C₁-C₁₀-carbonilo, H₂C, alcoxi de C₁-C₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi de C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-carboniloxi, arilcarboniloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), di-alquil (C₁-C₆)-aminocarboniloxi, alquil C₁-C₆-iminooxi, alquenil C₃-C₆-oxiimino, ariloxiimino, arilo (él mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterocicliloxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino, alquenil C₂-C₆-carbonilo, alquinil C₂-C₆-carbonilo, alquenil C₃-C₆-oxicarbonilo, alquinil C₃-C₆-oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido).

50 Los restos alquenilo y alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alquenilo, cuando sea apropiado, pueden tener la configuración (*E*) o (*Z*). Los ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los restos de alquenilo y de alquinilo pueden contener uno o más dobles y/o triples enlaces en cualquier combinación. Se entiende que alenilo y alquilinilalquenilo se incluyen en estos términos.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo incluyen aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquílico.

55 Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

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

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

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

Ejemplos preferidos de heteroarilos incluyen anillos de 5 miembros que están opcionalmente benzanillados, tales como tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, benzofurilo, tiazolilo, oxazolilo, isotiazolilo, benzotienilo, benzoisotienilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo y bencisoxazolilo. Estos anillos están opcionalmente sustituidos con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfínico o alquil C₁-C₃-sulfónico.

Otro grupo de heteroarilos preferidos incluyen anillos de 6 miembros que están opcionalmente benzanillados, tales como piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo y quinoxalinilo. Estos anillos están opcionalmente sustituidos con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfínico o alquil C₁-C₃-sulfónico.

El término “heterociclilo” se refiere preferiblemente a sistemas anulares no aromáticos, preferiblemente monocíclicos o bicíclicos, que contienen hasta 7 átomos, que incluyen uno o más (preferiblemente uno o dos) heteroátomos seleccionados de O, S y N. Ejemplos de tales anillos incluyen 1,3-dioxolano, oxetano, tetrahidrofurano, morfolina, tiomorfolina y piperazina. Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en heterociclilo incluyen alquilo de C₁-C₆ y haloalquilo de C₁-C₆ así como aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquilo.

Cicloalquilo incluye preferiblemente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Cicloalquilalquilo es preferiblemente ciclopropilmetilo. Cicloalquenilo incluye preferiblemente ciclopentenilo y ciclohexenilo. Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo incluyen alquilo de C₁₋₃ así como aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquílico.

Los anillos carbocíclicos incluyen arilo, cicloalquilo o grupos carbocíclicos, y grupos cicloalquenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclos se seleccionan preferiblemente de manera independiente de halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo (C₁-C₆), alquenilo de C₂-C₆, haloalquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo de C₅-C₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, alcoxi de C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), tri-alquil (C₁-C₄)-silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi de C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆), cicloalquil C₃-C₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), alquénil C₃-C₁₀-oxi, alquénil C₃-C₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀-tio, haloalquil C₁-C₁₀-tio, aril-alquil (C₁-C₄)-tio, cicloalquil C₃-C₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), tri-alquil (C₁-C₄)-silil-alquil (C₁-C₆)-tio, ariltio, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfínico, haloalquil C₁-C₆-sulfínico, arilsulfonilo, tri-alquil (C₁-C₄)-sililo, arildi-alquil (C₁-C₄)-sililo, alquil C₁-C₄-diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁-C₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi de C₁-C₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi de C₁-C₃)-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-carboniloxi, arilcarboniloxi, di-alquil (C₁-C₆)-aminocarboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil (C₁-C₆)-amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino, arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆) o dos posiciones adyacentes en un sistema arílico o heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆. Otros sustituyentes para arilo o heteroarilo incluyen arilcarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), alcoxi (C₁-C₆)-carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino, ariloxicarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), ariloxicarbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), arilsulfonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), arilsulfonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino (en el que el grupo

arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), aril-N-alquil (C₁-C₆)-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), arilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heteroarilamino (en el que el grupo heteroarilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heterociclicilamino (en el que el grupo heterociclico está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), aminocarbonilamino, alquil C₁-C₆-aminocarbonilamino, dialquil (C₁-C₆)-aminocarbonilamino, arilaminocarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), aril-N-alquil (C₁-C₆)-aminocarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), alquil C₁-C₆-aminocarbonil-N-alquil (C₁-C₆)-amino, dialquil (C₁-C₆)-aminocarbonil-N-alquil (C₁-C₆)-amino, arilaminocarbonil-N-alquil (C₁-C₆)-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno) y aril-N-alquil (C₁-C₆)-aminocarbonil-N-alquil (C₁-C₆)-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno).

Para grupos heterociclico sustituidos, se prefiere que uno o más sustituyentes se seleccionen independientemente de halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, nitro y ciano. Se entenderá que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos en los que los grupos dialquilo junto con el átomo de N al que están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo de C₁-C₆ seleccionados independientemente. Cuando los anillos heterocíclicos se forman uniendo dos grupos sobre un átomo de N, los anillos resultantes son adecuadamente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina, cada uno de los cuales puede estar sustituido con uno o dos grupos alquilo de C₁-C₆ seleccionados independientemente.

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

Entre los formadores de sales de metales de transición, de metales alcalinos y de metales alcalino-térreos, se debería hacer mención especial a los hidróxidos de cobre, hierro, litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero preferiblemente los hidróxidos, bicarbonatos y carbonatos de sodio y potasio.

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

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

Las bases preferidas de sulfonio terciario adecuadas para la formación de sal corresponde, por ejemplo, a la fórmula [SR_eR_fR_g]⁺OH, en la que R_e, R_f y R_g son cada uno, independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₄. Se prefiere de manera especial hidróxido de trimetilsulfonio. Las bases de sulfonio adecuadas se pueden obtener de la reacción de tioéteres, en particular de sulfuros de alquilo, con haluros de alquilo, seguido de la conversión en una base adecuada, por ejemplo un hidróxido, mediante reacciones de intercambio aniónico.

Se debería entender que en aquellos compuestos de fórmula I en la que G es un metal, amonio o sulfonio como se menciona anteriormente y como tal representa un catión, la carga negativa correspondiente está muy deslocalizada a lo largo de la unidad O-C=C-C=O.

Los compuestos de fórmula I según la invención también incluyen los hidratos que se pueden formar durante la formación de sales.

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

ventajas, tales como una penetración mejorada de la cutícula de las plantas tratadas, mayor tolerancia de los cultivos, compatibilidad o estabilidad mejorada en mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas, o lixiviación reducida en suelos.

5 El grupo protector G se selecciona preferiblemente de los grupos alquilo de C₁-C₈, haloalquilo de C₂-C₈, fenil-alquilo de C₁-C₈ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₈ (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquenilo de C₃-C₈, haloalquenilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h, en los que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son, cada uno independientemente entre sí, oxígeno o azufre;

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

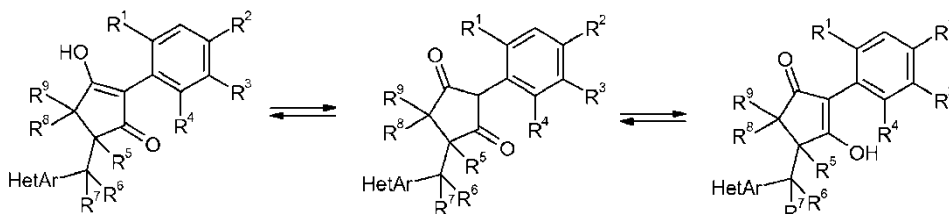
30 R^b es alquilo de C₁-C₁₈, alquenilo de C₃-C₁₈, alquinilo de C₃-C₁₈, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi de C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅),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

45 R^c y R^d son, cada uno independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₁₀, alquenilo de C₃-C₁₀, alquinilo de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi de C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquienil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi de C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo (C₁-C₅), N-alquil (C₁-C₅)-carbonil-N-alquil (C₂-C₅)-aminoalquilo, trialquil C₃-C₆-silit-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, difenilamino o difenilamino sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, o cicloalquil C₃-C₇-amino, di-cicloalquil C₃-C₇-amino o cicloalcoxi de C₃-C₇, o R^c y R^d se pueden unir para formar un anillo de 3-7 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O o S,

En particular, el grupo protector G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, y los significados de X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se definen anteriormente.

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

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



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

Para los fines de claridad, un compuesto de fórmula I, en la que G es H, se representa como un único tautómero, incluso si está presente en una forma tautómera diferente, o como una mezcla de formas tautómeras.

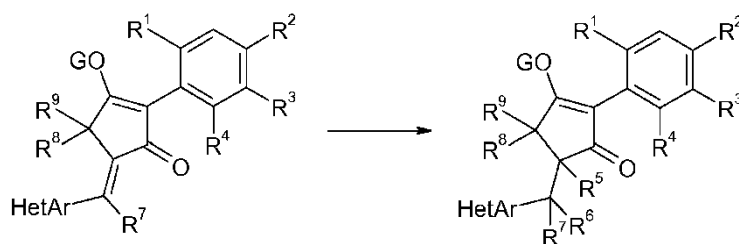
Preferiblemente, en los compuestos de la fórmula I,

- 15 R^1 es metilo, etilo, *n*-propilo, vinilo, etinilo, halógeno, alcoxi de C_1-C_2 o haloalcoxi de C_1-C_2 , especialmente metilo,
 R^2 es metilo, halógeno, alcoxi de C_1-C_2 o haloalcoxi de C_1-C_2 , o fenilo opcionalmente sustituido, especialmente metilo,
 R^3 es hidrógeno, y
 R^4 es metilo, etilo, *n*-propilo, vinilo, etinilo o metoxi,
- 20 R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , alqueno de C_2-C_4 , haloalqueno de C_2-C_4 , alquino de C_2-C_4 ,
 R^6 y R^7 o R^8 y R^9 , junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico opcionalmente sustituido o un heterociclilo opcionalmente sustituido, o R^5 y R^6 forman juntos un enlace, y
- 25 HetAr es heteroarilo o heteroarilo sustituido una a tres veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
 Más preferiblemente,
 R^1 es metilo o etilo, R^2 es metilo o cloro, R^3 es hidrógeno, R^4 es metilo, etilo o metoxi, R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son hidrógeno, o
 R^5 y R^6 forman juntos un enlace, y
- 30 HetAr es un heteroarilo de 5 o 6 miembros, o es un heteroarilo de 5 o 6 miembros que está sustituido una a tres veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
 Preferiblemente, los heteroátomos en estos restos HetAr se seleccionan de 1 o 2 átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre.
- 35 En particular, HetAr es tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, benzofurilo, tiazolilo, oxazolilo, isotiazolilo, benzotienilo, benzoisotienilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo y bencisoxazolilo, en el que estos anillos están opcionalmente sustituidos una o dos veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
 En particular, HetAr es piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo y quinoxalinilo, en el que estos anillos están opcionalmente sustituidos una o dos veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
- 40 En otro grupo de compuestos preferidos de la fórmula I, R^1 es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, halógeno o haloalcoxi de C_1-C_2 , especialmente etilo, R^2 es hidrógeno, R^3 es fenilo o piridilo, en el que estos anillos están

opcionalmente sustituidos una a tres veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo, y R⁴ es hidrógeno.

Ciertos compuestos de fórmula (I) son alquenos, y como tales sufren reacciones adicionales típicas de alquenos para dar compuestos adicionales de fórmula (I) según procedimientos conocidos. El ejemplo de tal reacción incluye, pero no se restringe a, halogenación o hidrogenación.

Los compuestos de fórmula (I) en los que R⁵ y R⁶ forman un enlace y R⁷ es halógeno, preferiblemente cloruro o bromuro, pueden experimentar una reacción de acoplamiento cruzado con una pareja adecuada de acoplamiento bajo condiciones descritas en la bibliografía para las reacciones de Suzuki-Miyaura, Sonogashira y reacciones de acoplamiento cruzado relacionadas, para dar compuestos adicionales de fórmula (I) (véanse, por ejemplo, O'Brien, C. J. y Organ, M. G. *Angew. Chem. Int. Ed.* (2007), 46, 2768-2813; Suzuki, A. *Journal of Organometallic Chemistry* (2002), 653, 83; Miyaura N. y Suzuki, A. *Chem. Rev.* (1995), 95, 2457-2483).



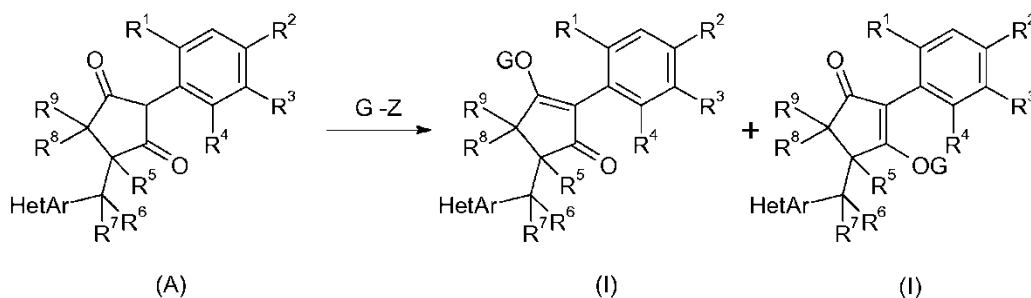
en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

Los expertos en la técnica apreciarán que los compuestos de fórmula (I) pueden contener un resto aromático que posee uno o más sustituyentes capaces de ser transformados en sustituyentes alternativos en condiciones conocidas, y que estos compuestos pueden servir ellos mismos como intermedios en la preparación de compuestos adicionales de fórmula (I).

Por ejemplo, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹, R², R³ o R⁴ es alqueniilo o alquilo, se pueden reducir a compuestos de fórmula (I) en la que R¹, R², R³ o R⁴ es alquilo en condiciones conocidas, y los compuestos de fórmula (I) en la que R¹, R², R³ o R⁴ es halógeno, preferiblemente bromuro o yodo, pueden experimentar una reacción de acoplamiento cruzado con una pareja adecuada de acoplamiento en condiciones descritas en la bibliografía para reacciones de Suzuki-Miyaura, Sonogashira y reacciones de acoplamiento cruzado relacionadas, para dar compuestos adicionales de fórmula (I) (véase, por ejemplo, O'Brien, C. J. y Organ, M. G. *Angew. Chem. Int. Ed.* (2007), 46, 2768-2813; Suzuki, A. *Journal of Organometallic Chemistry* (2002), 653, 83; Miyaura N. y Suzuki, A. *Chem. Rev.* (1995), 95, 2457-2483).

Los compuestos de fórmula (I) en la que G es alquilo de C₁-C₈, haloalquilo de C₂-C₈, fenil-alquilo de C₁-C₈ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sufinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₈ (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sufinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alqueniilo de C₃-C₈, haloalqueniilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h, en los que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e, X^f, R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R^f, R^g y R^h son como se definen anteriormente, se puede preparar tratando compuestos de fórmula (A), que son compuestos de fórmula (I) en la que G es H, con un reactivo G-Z, en el que G-Z es un agente alquilante tal como un haluro de alquilo (la definición de haluros de alquilo incluye haluros de alquilo de C₁-C₈ sencillos tales como yoduro de metilo y yoduro de etilo, haluros de alquilo sustituidos tales como éteres de clorometil-alquilo, Cl-CH₂-X^f-R^h, en los que X^f es oxígeno, y sulfuros de clorometil-alquilo Cl-CH₂-X^f-R^h, en los que X^f es azufre), un sulfonato de alquilo C₁-C₈, o un sulfato de di-alquilo de C₁-C₈, o con un haluro de alqueniilo de C₃-C₈, o con un haluro de alquinilo de C₃-C₈, o con un agente acilante tal como un ácido carboxílico, HO-C(X^a)R^a, en el que X^a es oxígeno, un cloruro de ácido, Cl-C(X^a)R^a, en el que X^a es oxígeno, o anhídrido de ácido, [R^aC(X^a)]₂O, en el que X^a es oxígeno, o un isocianato, R^cN=C=O, o un cloruro de carbamoilo, Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d (en el que X^d es oxígeno y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloruro de tiocarbamoilo Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d (en el que X^d es azufre y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno) o un cloroformiato, Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en el que X^b y X^c son oxígeno), o un clorotioformiato Cl-C(X^b)-X^c-R^b (en el que X^b es oxígeno y X^c es azufre), o un clorditioformiato Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en el que X^b y X^c son azufre), o un isotiocianato, R^cN=C=S, o por tratamiento secuencial con disulfuro de carbono y un agente alquilante, o con un agente fosforilante tal como un cloruro de fosforilo, Cl-P(X^e)(R^f)-R^g, o con un agente sulfonilante tal como un cloruro de sulfonilo Cl-SO₂-R^e, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de base.

Se pueden formar compuestos isoméricos de fórmula (I). Por ejemplo, los compuestos de fórmula (A) pueden dar lugar a dos compuestos isoméricos de fórmula (I), o a mezclas isoméricas de compuestos de fórmula (I). Esta invención cubre ambos compuestos isoméricos de fórmula (I), junto con mezclas de estos compuestos en cualquier relación.



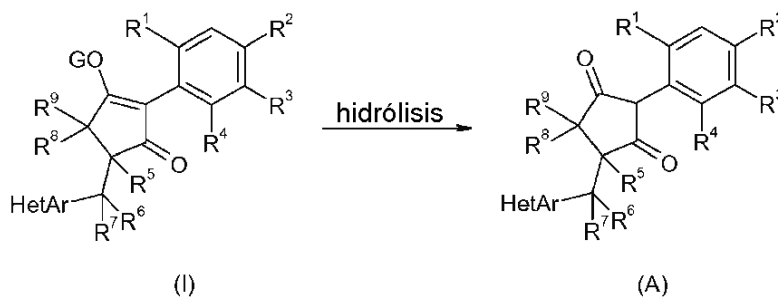
La O-acilación de 1,3-dionas cíclicas es conocida; los métodos adecuados se describen, por ejemplo, en el documento US4436666. Se han publicado procedimientos alternativos por Pizzorno M. T. y Albonico S. M., Chem. Ind. (Londres), (1972), 425; Born, H. et al. J. Chem. Soc. (1953), 1779; Constantino, M. G. et al. Synth. Commun. (1992), 22 (19), 2859; Tian, Y. et al. Synth. Commun. (1997), 27 (9), 1577; Chandra Roy, S. et al., Chem. Lett. (2006), 35 (1), 16; Zubaidha, P. K. et al. Tetrahedron Lett. (2004), 45, 7187 and by Zwanenburg, B. et al. Tetrahedron (2005), 45 (22), 7109.

La acilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar por procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, en los documentos US4551547, US4175135, US4422870, US4659372 y US4436666. Típicamente, las dionas de fórmula (A) se pueden tratar con un agente acilante, en presencia de al menos un equivalente de una base adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado. La base puede ser inorgánica, tal como un carbonato o hidróxido de un metal alcalino, o un hidruro metálico, o una base orgánica tal como una amina terciaria o un alcóxido metálico. Ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, hidróxido de sodio o potasio, hidruro de sodio, y las bases orgánicas adecuadas incluyen trietilaminas, tales como trimetilamina y trietilamina, piridinas u otras bases amínicas tales como 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los disolventes adecuados para esta reacción se seleccionan de forma que sean compatibles con los reactivos, e incluyen éteres tales como tetrahidrofurano y 1,2-dimetoxietano, y disolventes halogenados tales como diclorometano y cloroformo. Se pueden emplear ciertas bases, tales como piridina y trietilamina, de forma satisfactoria tanto como bases como disolventes. Para los casos en los que el agente acilante es un ácido carboxílico, la acilación se efectúa preferiblemente en presencia de un agente de acoplamiento, tal como yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, *N,N'*-diclohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y *N,N'*-carbodiimidazol, y opcionalmente una base tal como trietilamina o piridina en un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano, diclorometano o acetonitrilo. Procedimientos adecuados se describen, por ejemplo, por Zhang, W. y Pugh, G. Tetrahedron Lett. (1999), 40 (43), 7595, e Isobe, T. e Ishikawa, T. J. Org. Chem. (1999), 64 (19) 6984.

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

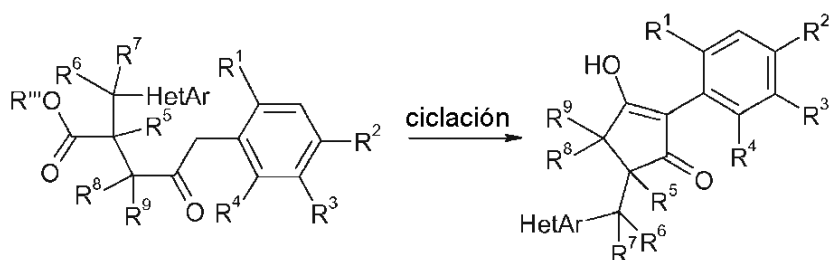
La sulfonilación de un compuesto de fórmula (A) se puede lograr usando un haluro de alquil- o arilsulfonilo, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de base, por ejemplo mediante el procedimiento de Kowalski, C. J. y Fields, K. W. J. Org. Chem. (1981), 46, 197.

Los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (I) mediante hidrólisis, preferiblemente en presencia de un catalizador ácido tal como ácido clorhídrico y opcionalmente en presencia de disolvente tal como tetrahidrofurano o acetona, preferiblemente entre 25°C y 150°C bajo calentamiento convencional o bajo irradiación de microondas.

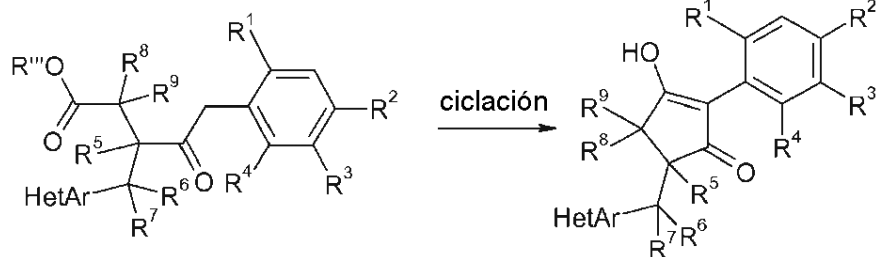


En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula (A) se puede preparar mediante la ciclación de un compuesto de fórmula (B) o compuestos de fórmula (C), en los que R''' es hidrógeno o un grupo alquilo, preferiblemente en presencia de un ácido o una base, y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, mediante métodos análogos a los descritos por T. N. Wheeler, documento US4209532. Los compuestos de fórmula (B) y fórmula (C) han sido diseñados particularmente como intermedios en la síntesis de los compuestos de fórmula (I). Los compuestos de fórmula (B) o compuestos de fórmula (C), en los que R''' es hidrógeno, se pueden ciclar en

condiciones ácidas, preferiblemente en presencia de un ácido fuerte tal como ácido sulfúrico, ácido polifosfórico o reactivo de Eaton, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado tal como ácido acético, tolueno o diclorometano.



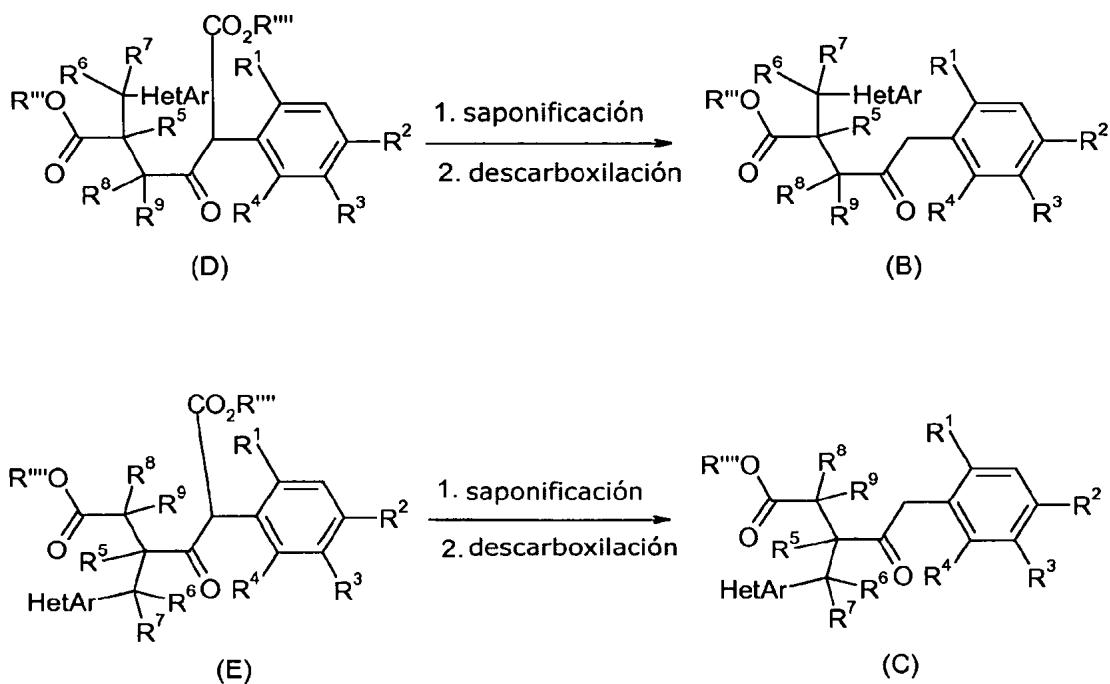
(B)



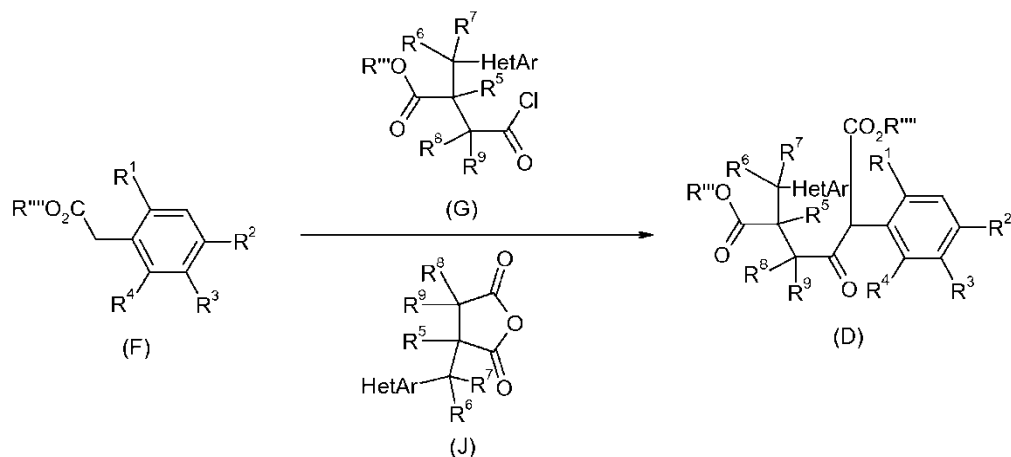
(C)

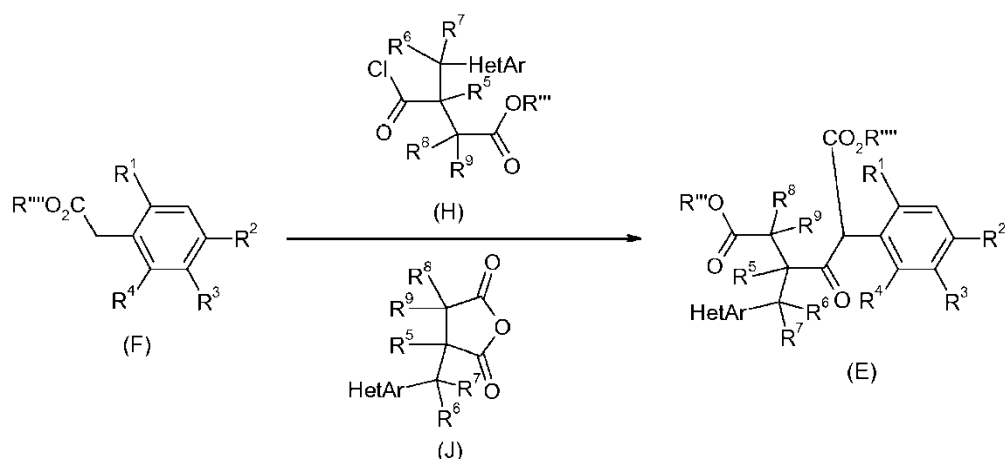
(A)

- 5 Los compuestos de fórmula (B) o compuestos de fórmula (C), en los que R^{'''} es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), se pueden ciclar en condiciones ácidas o básicas, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de una base fuerte tal como *tert*-butóxido de potasio, diisopropilamido de litio o hidruro de sodio, y en un disolvente tal como tetrahidrofurano, tolueno, dimetilsulfóxido o *N,N*-dimetilformamida.
- 10 Los compuestos de fórmula (B) o compuestos de fórmula (C), en los que R^{'''} es H, se pueden esterificar a, respectivamente, compuestos de fórmula (B) y compuestos de fórmula (C), en los que R^{'''} es alquilo, en condiciones estándar, por ejemplo calentando con un alcohol alquílico, ROH, en presencia de un catalizador ácido.
- 15 Los compuestos de fórmula (B) o compuestos de fórmula (C), en los que R^{'''} es H, se pueden preparar, respectivamente, por saponificación de compuestos de fórmula (D) y compuestos de fórmula (E), en los que R^{''''} es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), en condiciones estándar, seguido de acidificación de la mezcla de reacción para efectuar la descarboxilación, mediante procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, por T. N. Wheeler, documento US4209532.



Los compuestos de fórmula (D) y compuestos de fórmula (E), en los que R^{m} es alquilo, se pueden preparar tratando, respectivamente, compuestos de fórmula (F) con cloruros de ácidos carboxílicos adecuados de fórmula (G), o cloruros de ácidos carboxílicos adecuados de fórmula (H), en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen *tert*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amido de sodio y diisopropilamido de litio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura entre -80°C y 30°C. Alternativamente, los compuestos de fórmula (D) y compuestos de fórmula (E), en los que R^{m} es H, se pueden preparar tratando un compuesto de fórmula (F) con una base adecuada (tal como *tert*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amido de sodio y diisopropilamido de litio) en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura adecuada (entre -80°C y 30°C), y haciendo reaccionar el anión resultante con un anhídrido adecuado de fórmula (J):

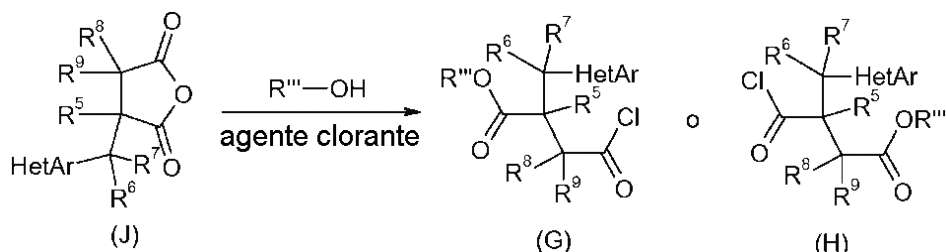




Los compuestos de fórmula (F) son compuestos conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

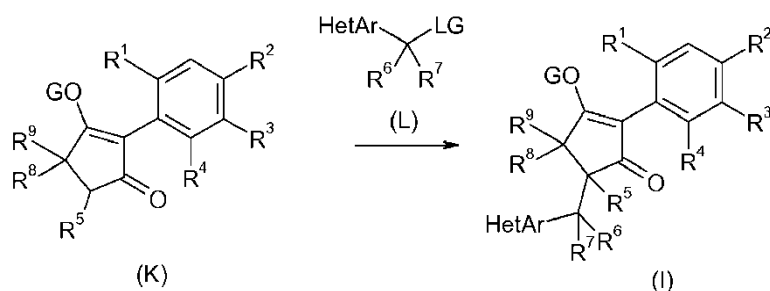
- 5 Los compuestos de fórmula (J) se pueden preparar, por ejemplo, por métodos análogos a los descritos por Ballini, R. et al. *Synthesis* (2002), (5), 681-685; Bergmeier, S. C. e Ismail, K. A. *Synthesis* (2000), (10), 1369-1371; Groutas, W. C. et al. *J. Med. Chem.* (1989), 32 (7), 1607-11 y Bernhard, K. y Lincke, H. *Helv. Chim. Acta* (1946), 29, 1457-1466.

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



- 15 Los compuestos de fórmula (G) y los compuestos de fórmula (H) se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos. Por ejemplo, los métodos análogos para obtener compuestos de fórmula (G) y compuestos de fórmula (H) se describen por Bergmeier, S. C. e Ismail, K. A. *Synthesis* (2000), (10), 1369-1371.

- 20 En un enfoque adicional, los compuestos de fórmula (I) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (K) con compuestos de fórmula (L) en la que LG es un grupo saliente tal como halógeno (preferiblemente yoduro o bromuro) o un alcohol activado (preferiblemente mesilato o tosilato) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C.



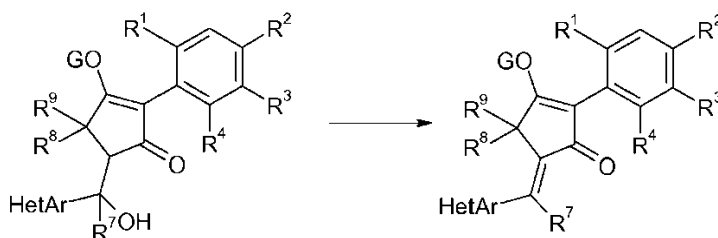
- 25 Los compuestos de fórmula (L) son conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos.

Los compuestos de fórmula (K) son compuestos conocidos o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Song, Y. S. S. et al. *Tetrahedron Lett.* (2005), 46 (46), 5987-5990; Kuethe, J. T. et al. *J. Org. Chem.* (2002), 67 (17), 5993-6000).

- 5 De manera alternativa, los compuestos de fórmula (K), en los que G es alquilo de C₁-C₆, se pueden preparar por alquilación de compuestos de fórmula (K), en los que G es hidrógeno, en condiciones conocidas o por métodos conocidos (véase, por ejemplo, Eberhardt, U. et al. *Chem. Ber.* (1983), 116 (1), 119-135).

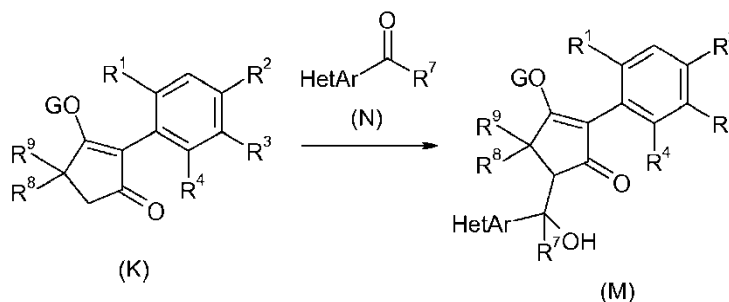
- 10 Los compuestos de fórmula (K) en los que G es hidrógeno, son conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Nguyen, H. N. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (2003), 125 (39), 11818-11819; Bonjoch, J. et al. *Tetrahedron* (2001), 57(28), 6011-6017; Fox, J. M. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (2000), 122(7), 1360-1370; documentos US4338122; US4283348).

- 15 De manera alternativa, los compuestos de fórmula (I) en los que R⁵ y R⁶ forman un enlace se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (M) mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Habib-Zahmani, H. et al. *Synlett* (2007), (7), 1037-1042; Nagaoka, H. et al. *Tetrahedron Letters* (1985), 26 (41), 5053-5056; Nagaoka, H. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (1986), 108 (16), 5019-5021; Zuki, M. et al. *Bull. Chem. Soc. Japan* (1988), 61(4), 1299-1312; Enholm, E. J. et al. *J. Org. Chem.* (1996), 61 (16), 5384-5390; Clive, D. L. J. et al. *Tetrahedron* (2001), 57 (18), 3845-3858; Bartoli, G. et al. *J. Org. Chem.* (2002), 67 (25), 9111-9114. Jung, M. E. et al. *Chem. Comm.* (2003), (2), 196-197; documentos EP1433772; JP2004203844; IN 194295).



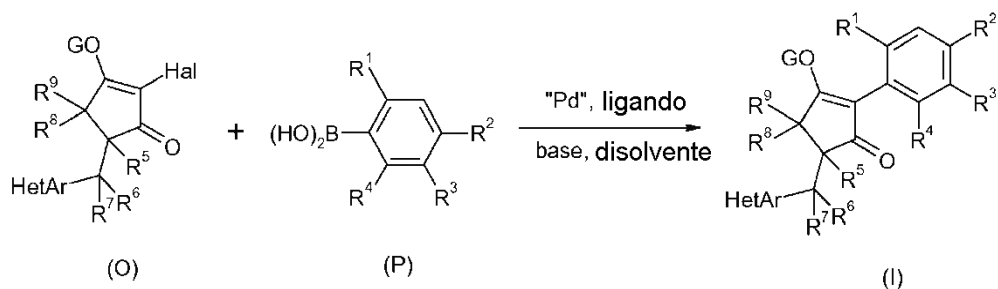
en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

- 20 Los compuestos de fórmula (M) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (K) con compuestos de fórmula (N) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahydrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C.



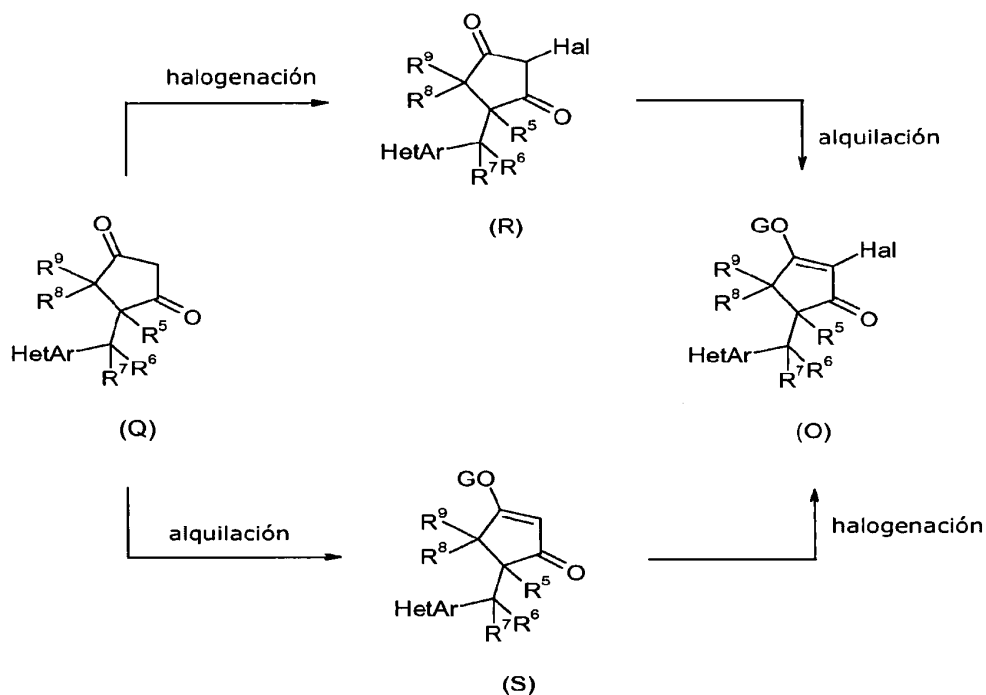
- 25 Los compuestos de fórmula (N) son compuestos conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos.

- 30 Los compuestos de fórmula (I) (en la que G es alquilo de C₁₋₄) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (O) (en la que G es alquilo de C₁₋₄, y Hal es halógeno, preferiblemente bromo o yodo) con ácidos arilborónicos, Ar-B(OH)₂, de fórmula (P) en presencia de un catalizador de paladio adecuado (por ejemplo 0,001-50% de acetato de paladio(II) con respecto al compuesto (O)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de fosfato de potasio con respecto al compuesto (O)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0,001-50% de (2-diciclohexilfosfino)-2',6'-dimetoxibifenilo con respecto al compuesto (O)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo tolueno o 1,2-dimetoxietano), preferiblemente entre 25°C y 200°C bajo calentamiento convencional o bajo irradiación de microondas (véanse, por ejemplo, Song, Y. S. S. et al. *Tetrahedron Lett.* (2005), 46 (46), 5987-5990; Kuethe, J. T. et al. *J. Org. Chem.* (2002), 67(17), 5993-6000).
- 35



5

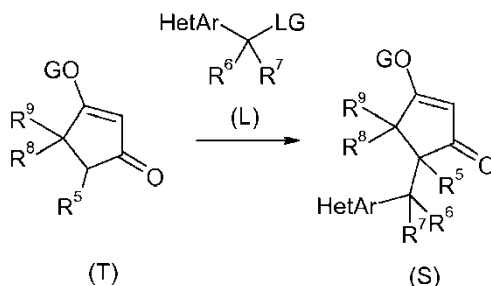
Un compuesto de fórmula (O) se puede preparar halogenando un compuesto de fórmula (Q), seguido de la alquilación del haluro resultante de fórmula (R) con un haluro de alquilo de C₁₋₄ u ortoformiato de trialquilo de C₁₋₄ en condiciones conocidas, por ejemplo mediante los procedimientos de Shepherd R. G. et al. J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 2153-2155 y Lin Y.-L. et al. Bioorg. Med. Chem. (2002), 10, 685-690. Como alternativa, los compuestos de fórmula (O) se pueden preparar alquilando un compuesto de fórmula (Q) con un haluro de alquilo de C₁₋₄ o un ortoformiato de trialquilo de C₁₋₄, y halogenando la enona resultante de fórmula (S) en condiciones conocidas (véanse, por ejemplo, Song, Y. S. et al. Tetrahedron Lett. (2005), 46 (36), 5987-5990; Kuethe, J. T. et al. J. Org. Chem. (2002), 67(17), 5993-6000; Belmont, D. T. et al. J. Org. Chem. 1985, 50 (21), 4102-4107).



10

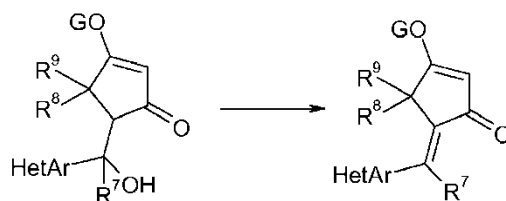
15

Los compuestos de fórmula (S) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (T) con compuestos de fórmula (L) en los que LG es un grupo saliente tal como halógeno (preferiblemente yoduro o bromuro) o una alcohol activado (preferiblemente mesilato o tosilato) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *terc*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véanse, por ejemplo, Gulias, M. et al. Org. Lett. (2003), 5(11), 1975-1977; Altenbach, R. J. et al. J. Med. Chem. (2006), 49 (23), 6869-6887; Snowden, R. L. Tetrahedron (1986), 42 (12), 3277-90; Oppolzer, W. et al. Helv. Chim. Acta (1980), 63 (4), 788-92; Mellor, M. et al. Synth. Commun. 1979, 9 (1), 1-4).



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

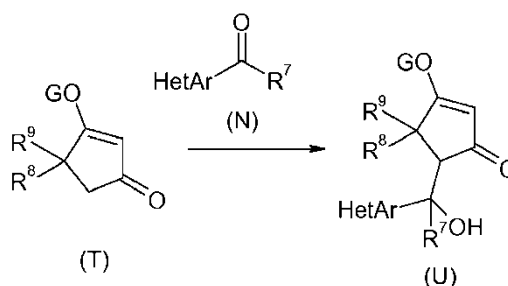
De manera alternativa, los compuestos de fórmula (S) en los que R⁵ y R⁶ forman un enlace se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (U) por métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Nagaoka, H. et al. *Tetrahedron Letters* (1985), 26 (41), 5053-5056; Nagaoka, H. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (1986), 108 (16), 5019-5021; zuki, M. et al. *Bull. Chem. Soc. Japon* (1988), 61(4), 1299-1312; Enholm, E. J. et al. *J. Org. Chem.* (1996), 61(16), 5384-5390; Clive, D. L. J. et al. *Tetrahedron* (2001), 57 (18), 3845-3858; Bartoli, G. et al. *J. Org. Chem.* (2002), 67 (25), 9111-9114. Jung, M.E. et al. *Chem. Comm.* (2003), (2), 196-197; documentos EP1433772; JP2004203844; IN194295).



10

en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

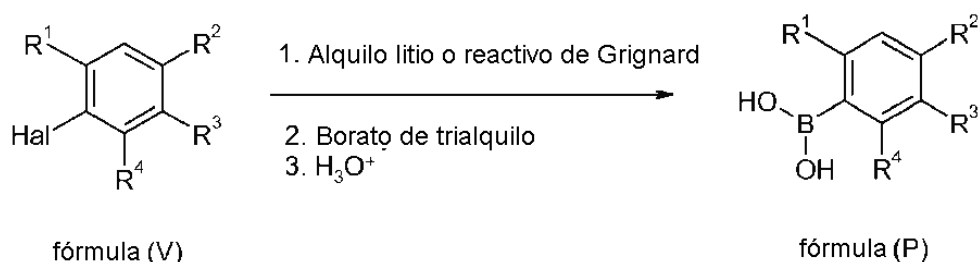
Los compuestos de fórmula (U) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (T) con compuestos de fórmula (N) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véase, por ejemplo, Aleman, J. et al. *Chem. Comm.* (2007), (38), 3921-3923).



15

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

20



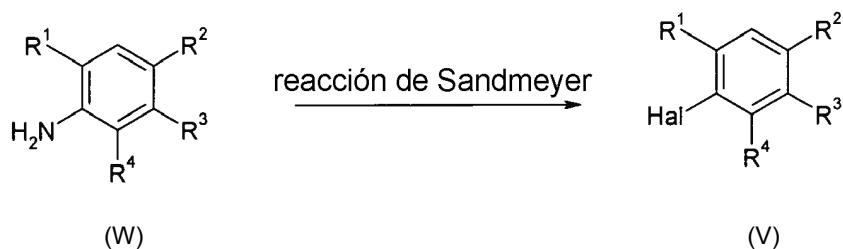
25

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

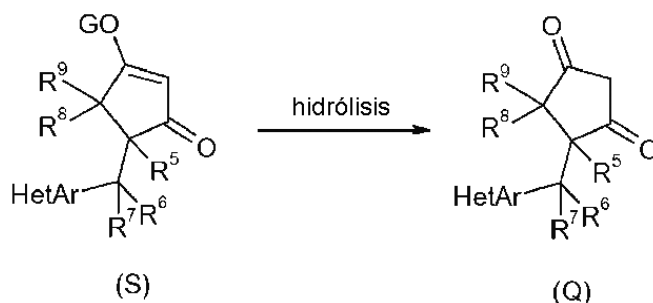
30

Los haluros de arilo de fórmula (V) se pueden preparar a partir de anilinas de fórmula (W) por métodos conocidos, por ejemplo la reacción de Sandmeyer, vía las sales de diazonio correspondientes.

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

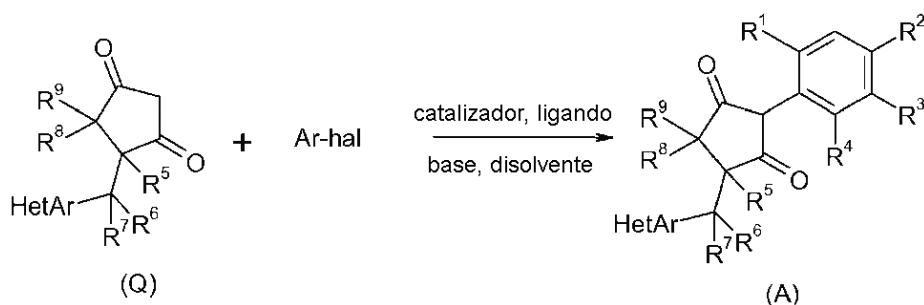


5 Los compuestos de fórmula (Q) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (S) por hidrólisis, preferiblemente en presencia de un catalizador ácido tal como ácido clorhídrico y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano o acetona, preferiblemente entre 25°C y 150°C bajo calentamiento convencional o bajo irradiación de microondas.

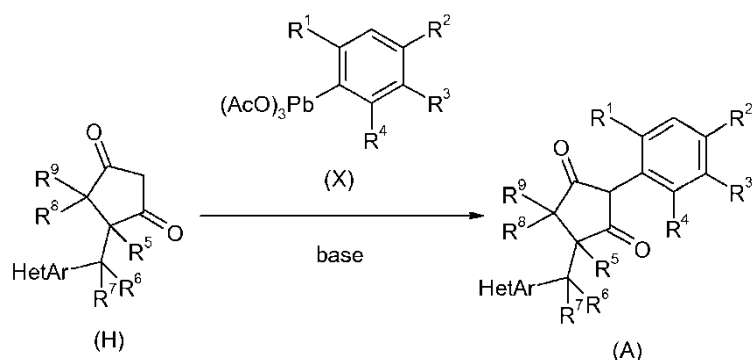


10 De manera alternativa, los compuestos de fórmula (Q) se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos (véase, por ejemplo, Manukina, T. A. et al. Zhurnal Organicheskoi Khimii (1986), 22(4), 873-4; Mellor, M. et al. Synth. Commun. 1979, 9 (1), 1-4).

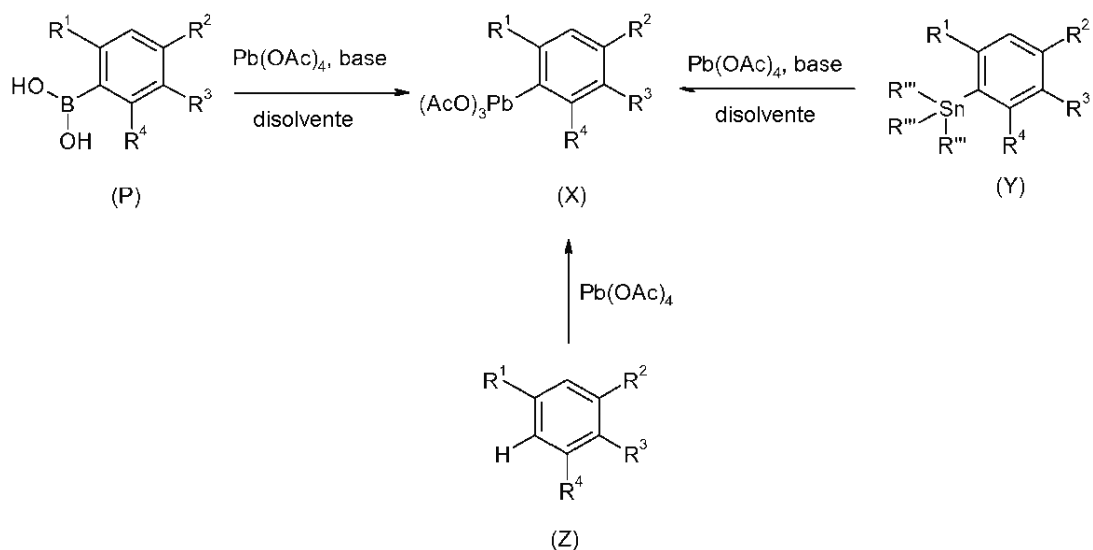
15 En un enfoque adicional, los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (Q) con haluros de arilo adecuados (tales como yoduros de arilo, bromuros de arilo o cloruros de arilo), Ar-Hal, en presencia de un catalizador de paladio adecuado (por ejemplo 0,001-50% de acetato de paladio(II) con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de fosfato de potasio con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0,001-50% de (2-diciclohexilfosfino)-2',4',6'-trisisopropilbifenilo con respecto a compuestos de fórmula (Q)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo dioxano o 1,2-dimetoxietano), preferiblemente entre 25°C y 200°C. En la bibliografía se conocen acoplamientos similares (véanse, por ejemplo, Belmont, D. T. et al. J. Org. Chem. 1985, 50 (21), 4102-4107; Fox, J. M. et al. J. Am. Chem. Soc. (2000), 122 (7), 1360-1370; B. Hong et al., documento WO 2005/000233). De manera alternativa, los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (Q) con haluros de arilo adecuados (tal como yoduros de arilo), Ar-Hal, en presencia de un catalizador de cobre adecuado (por ejemplo 0,001-50% de yoduro de cobre (I) con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de carbonato de potasio con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0,001-50% de L-prolina con respecto a compuestos de fórmula (Q)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo dimetilsulfóxido), preferiblemente entre 25°C y 200°C. Se conocen acoplamientos similares en la bibliografía para haluros de arilo (véase, por ejemplo, Jiang, Y. et al. Synlett (2005), 18, 2731-2734).



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



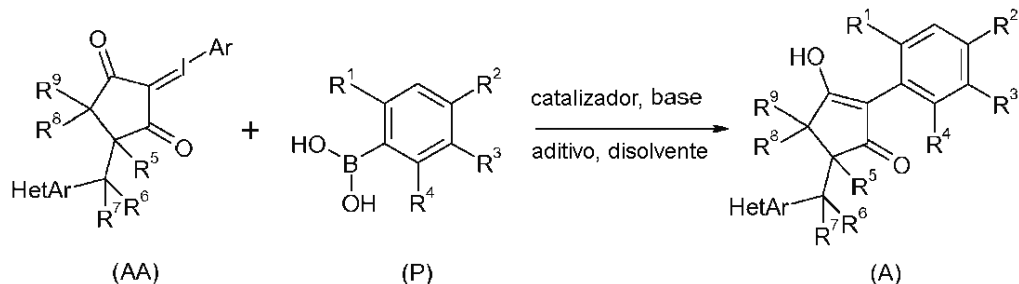
El reactivo órgano-plumbífero de fórmula (X) se puede preparar a partir de un ácido borónico de fórmula (P), un estannano de fórmula (Y), en la que R'''' es alquilo de C1-C4, o mediante plumbación directa de un compuesto de fórmula (Z) con tetraacetato de plomo según procedimientos conocidos.



5

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

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



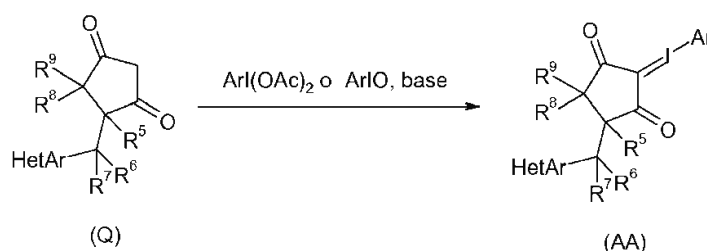
15 Los catalizadores de paladio adecuados son generalmente complejos de paladio(II) o paladio(0), por ejemplo dihaluros de paladio(II), acetato de paladio(II), sulfato de paladio(II), dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II), dicloruro de bis(triciclohexilfosfina)paladio(II), dicloruro de bis(triciclohexilfosfina)paladio(II), bis(dibencilidienacetona)paladio(0) o tetraquis(trifenilfosfina)paladio(0). El catalizador de paladio también se puede preparar *in situ* a partir de compuestos de paladio(II) o paladio(0) complejándolos con los ligandos deseados, por ejemplo combinando la sal de paladio(II) a complejar, por ejemplo dicloruro de paladio(II) (PdCl₂) o acetato de paladio(II) (Pd(OAc)₂), junto con el ligando deseado, por ejemplo trifenilfosfina (PPh₃), triciclohexilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo o 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-trisopropilbifenilo y el

20

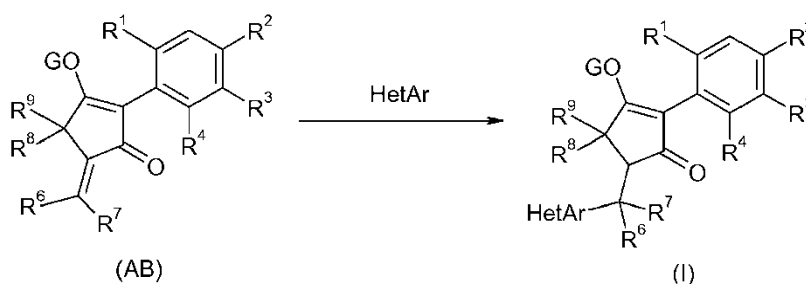
disolvente seleccionado, con un compuesto de fórmula (AA), el ácido arilborónico de fórmula (P) y una base. También son adecuados los ligandos bidentados, por ejemplo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno o 1,2-bis(difenilfosfino)etano. Calentando el medio de reacción, el complejo de paladio(II) o complejo de paladio(0) deseado para la reacción de acoplamiento C-C se forma así *in situ*, y después inicia la reacción de acoplamiento C-C.

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

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

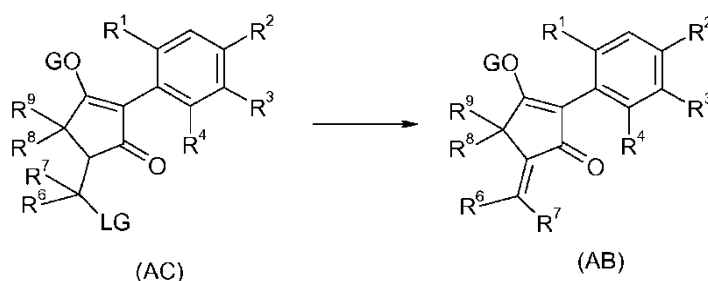


De manera alternativa, los compuestos de fórmula (I) se pueden preparar por reacción de compuestos heteroaromáticos (preferiblemente tiofeno, pirrol o furano) con compuestos de fórmula (AB)



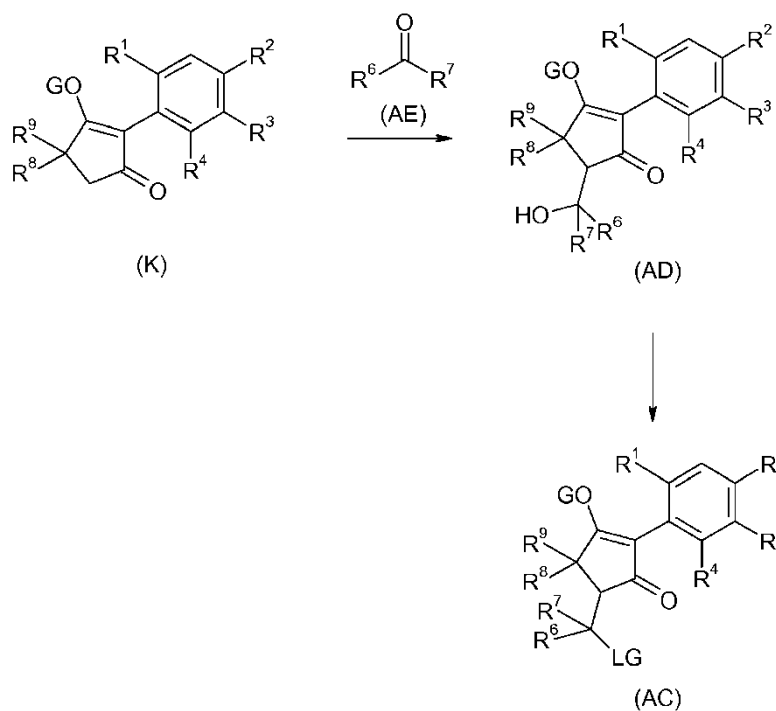
en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

Los compuestos de fórmula (AB) se pueden preparar a partir de compuesto (AC), en los que LG es un grupo saliente tal como halógeno (preferiblemente yoduro o bromuro), un alcohol activado (preferiblemente mesilato o tosilato) en condiciones básicas por métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Drege, E. et al. *Tetrahedron Letters* (2005), 46(42), 7263-7266 y Drege, E. et al. *Eur. J. Org. Chem.* (2006), (21), 4825-4840).

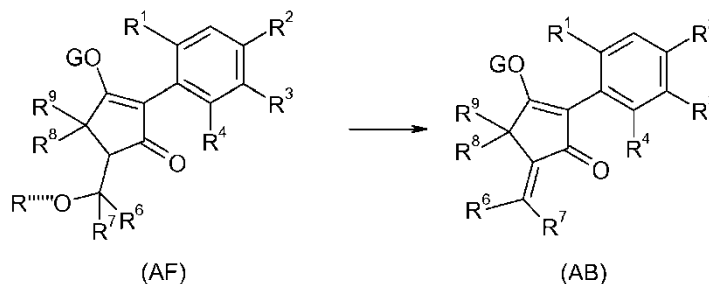


en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

Los compuestos de fórmula (AC) se pueden preparar, por ejemplo, a partir de compuestos de fórmula (K) con compuestos de fórmula (AE) en condiciones básicas, seguido de una activación del grupo hidroxilo de los compuestos (AD). Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véanse, por ejemplo, Drege, E. et al. *Tetrahedron Letters* (2005), 46 (42), 7263-7266 y Drege, E. et al. *Eur. J. Org.* (2006), (21), 4825-4840).



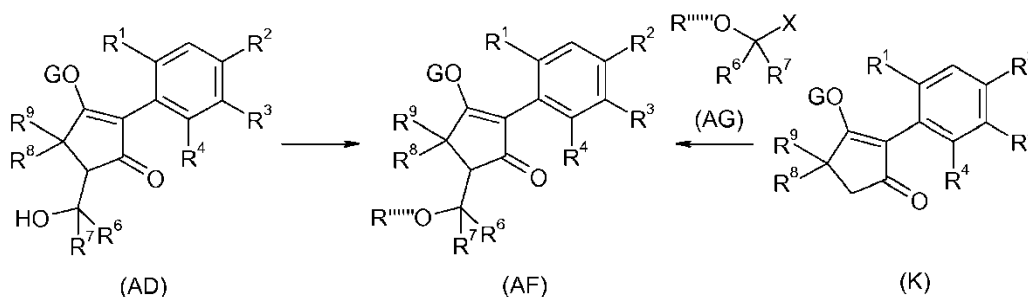
Los compuestos de fórmula (AB) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (AF), en los que R^{''''''} es un grupo alquilo (preferiblemente metilo o etilo) en condiciones ácidas por métodos conocidos.



5

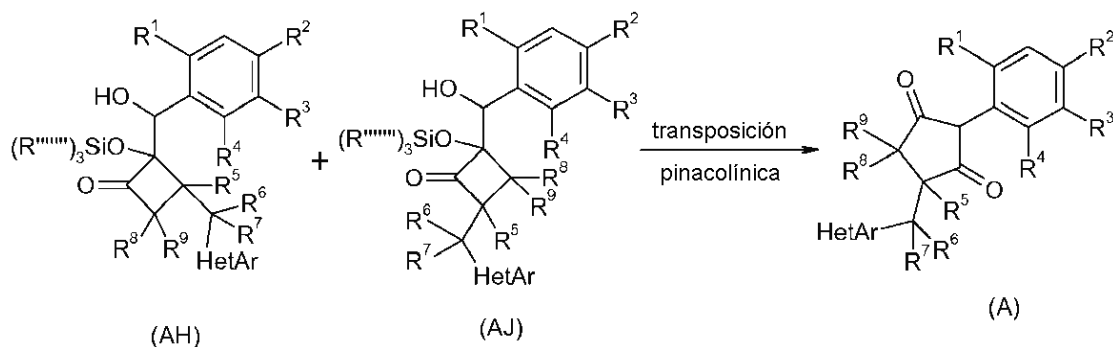
en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

Los compuestos de fórmula (AF) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (AD) mediante alquilación del grupo hidroxilo libre en condiciones conocidas, o por reacción de compuestos de fórmula (K) con compuestos de fórmula (AG) en condiciones conocidas (véase, por ejemplo, Imanishi, T. et al. . J. Chem. Soc. Chem. Comm. (1987), (23), 1802-1804).

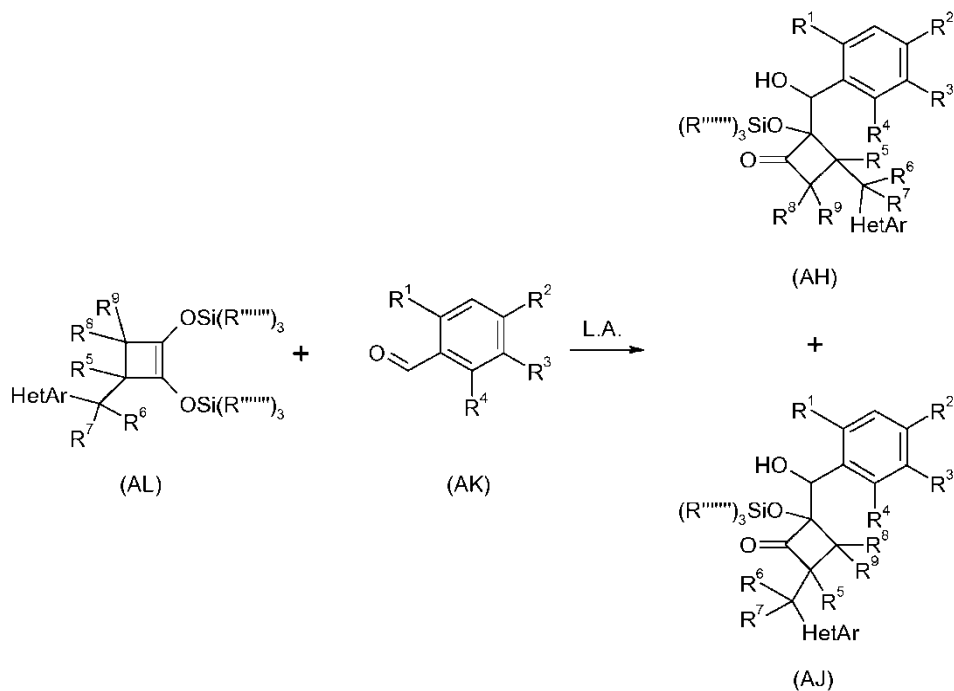


10

Compuestos adicionales de fórmula (A) se pueden preparar mediante la transposición pinacolínica de compuestos de fórmula (AH) o compuestos de fórmula (AJ), en los que R^{''''''} es alquilo de C₁-C₄ (preferiblemente metilo) en condiciones ácidas (véanse, por ejemplo, Eberhardt, U. et al. Chem. Ber. (1983), 116(1), 119-35 y Wheeler, T.N., documento US4283348).

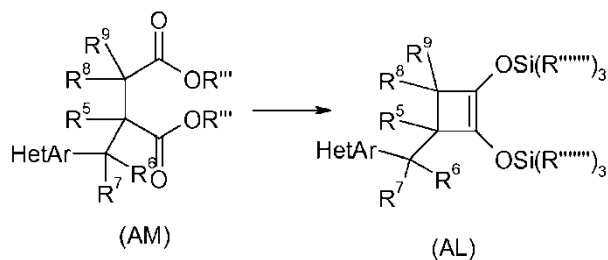


5 Los compuestos de fórmula (AH) y los compuestos de fórmula (AJ) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (AK) con compuestos de fórmula (AL) en presencia de un ácido (tal como cloruro de titanio o yoduro de magnesio) opcionalmente en un disolvente adecuado (tal como diclorometano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véanse, por ejemplo, Li, W.-D.Z. y Zhang, X.-X. *Org. Lett.* (2002), 4(20), 3485-3488; Shimada, J. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (1984), 106(6), 1759-73; Eberhardt, U. et al. *Chem. Ver.* (1983), 116(1), 119-35 y Wheeler, T.N., documento US4283348).



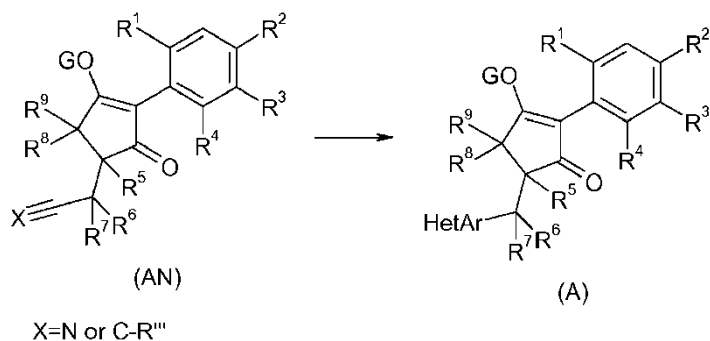
10 Los compuestos de fórmula (AK) son conocidos, o se pueden obtener por métodos conocidos a partir de compuestos de fórmula (V).

15 Los compuestos de fórmula (AL) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (AM) en los que R''' es un grupo alquilo (preferiblemente metilo) en presencia de cloro-tri-alquilo C₁-C₄-sililo y un metal (preferiblemente sodio) en un disolvente adecuado (tal como tolueno o éter dietílico) a una temperatura entre 20°C y 150°C (véanse, por ejemplo, Blanchard, A. N. y Burnell, D. J. *Tetrahedron Lett.* (2001), 42(29), 4779-4781 y Salaun, J. et al. *Tetrahedron* (1989), 45(10), 3151-62).

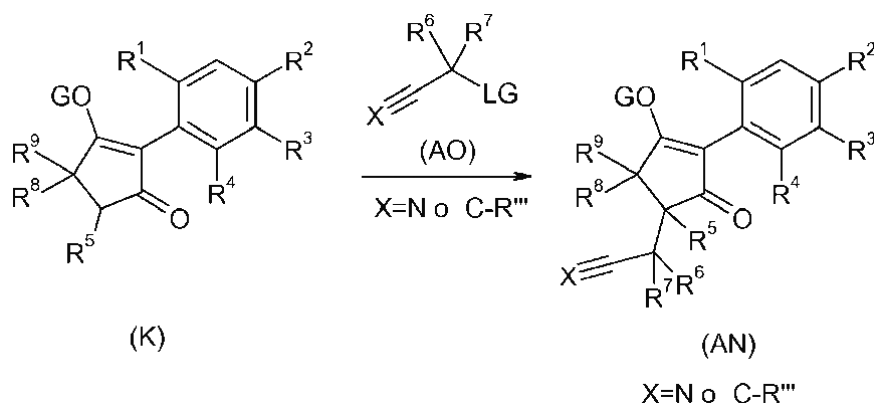


Los compuestos de fórmula (AM) son análogos a los compuestos de fórmula (H) y compuestos de fórmula (G), y se pueden preparar por métodos análogos a los descritos para los compuestos de fórmula (H) y compuestos de fórmula (G).

- 5 Compuestos adicionales de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (AN) en los que X es N o C-R''', en el que R''' es un grupo alquilo (preferiblemente metilo) con 1,3-dipolo en métodos análogos a los descritos por Huisgen. R. Angew. Chem. Int. Ed. (1963), 565-632.



- 10 Los compuestos de fórmula (AN) se pueden obtener haciendo reaccionar compuestos de fórmula (K) con compuestos de fórmula (AO), en los que LG es un grupo saliente tal como halógeno (preferiblemente yoduro o bromuro) o un alcohol activado (preferiblemente mesilato o tosilato) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahydrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C. Se describen reacciones similares por Gulias, M. et al. Org. Lett. (2003), 5(11), 1975-1977.



- 15 Los compuestos de fórmula I según la invención se pueden usar como herbicidas en forma no modificada, como se obtienen en la síntesis, pero generalmente se formulan en composiciones herbicidas de diversas formas usando compuestos auxiliares de la formulación, tales como vehículos, disolventes y sustancias tensoactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, por ejemplo en forma de polvos finos, geles, polvos humectables, gránulos revestidos o impregnados para distribución manual o mecánica en los sitios diana, gránulos dispersables en agua, gránulos solubles en agua, gránulos emulsionables, comprimidos dispersables en agua, comprimidos prensados efervescentes, cintas solubles en agua, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua (EW) o de agua en aceite (WO), otros sistemas multifásicos tales como productos de aceite/agua/aceite y de agua/aceite/agua, sustancias oleosas capaces de fluir, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspensiones emulsiones, suspensiones en cápsulas, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible con el agua como vehículo), películas de polímero impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo, por The Manual on Development and Use of
- 20 FAO Specifications for Plant Protection Products, 5ª Edición, 1999. El ingrediente activo se puede incorporar en microfibras o micro-varillas formadas de polímeros o monómeros polimerizables y que tienen un diámetro de alrededor de 0,1 a alrededor de 50 micrómetros, y una relación de aspecto de entre alrededor de 10 y alrededor de
- 30 1000.

Dichas formulaciones se pueden usar tanto directamente como diluidas antes del uso. Entonces se pueden aplicar a través de equipo adecuado de aspersión de aplicación en tierra o aérea u otro equipo de aplicación en tierra tal como sistemas de irrigación de pivote central o medios de irrigación de goteo/chorrito.

- 35 Las formulaciones diluidas se pueden preparar, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceites o disolventes.

Las formulaciones se pueden preparar, por ejemplo, mezclando el ingrediente activo con los compuestos auxiliares de la formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, disoluciones, dispersiones o emulsiones. Los ingredientes activos también pueden estar contenidos en microcápsulas finas que consisten en un núcleo y una cubierta de polímero. Las microcápsulas tienen habitualmente un diámetro de 0,1 a 500 micrómetros. Contienen ingredientes activos en una cantidad de alrededor de 25 a 95% en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar presentes en forma de una disolución adecuada, en forma de partículas finas en una dispersión sólida o líquida, o como un sólido monolítico. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, gomas naturales y sintéticas, celulosa, copolímeros de estireno-butadieno u otro material formador de membrana adecuado similar, poliácridonitrilo, poliácridato, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretano, resinas aminoplast, o almidón modificado químicamente, u otros polímeros que son conocidos por la persona experta en la técnica a este respecto.

Alternativamente, es posible formar las denominadas "microcápsulas" finas en las que el ingrediente activo está presente en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de sustancia base, pero en ese caso la microcápsula no está encapsulada con una membrana limitante de la difusión como se describe en el párrafo anterior.

Los ingredientes activos se pueden adsorber sobre un portador poroso. Esto puede permitir que los ingredientes activos se liberen en su entorno circundante en cantidades controladas (por ejemplo, liberación lenta). Otras formas de formulaciones de liberación controlada son gránulos o polvos en los cuales el ingrediente activo se dispersa o disuelve en una matriz sólida que consiste en un polímero, una cera o una sustancia sólida adecuada de bajo peso molecular. Los polímeros adecuados son poliácetato de vinilo, poliestirenos, poliolefinas, polialcoholes vinílicos, polivinil-pirrolidonas, polivinil-pirrolidonas alquiladas, copolímeros de polivinil-pirrolidonas y anhídrido maleico, y ésteres y semiésteres de los mismos, ésteres de celulosa químicamente modificados tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa, hidroxietilcelulosa, ejemplos de ceras adecuadas son cera de polietileno, cera de polietileno oxidado, ceras de éster tal como ceras de montana, ceras de origen natural tales como cera de carnauba, cera de candelilla, cera de abejas, etc.

Otros materiales de matriz adecuados para formulaciones de liberación lentas son almidón, estearina, lignina.

Los compuestos auxiliares de la formulación adecuados para la preparación de las composiciones según la invención son conocidos *per se*.

Como los portadores líquidos se pueden usar: agua, disolventes aromáticos tal como tolueno, m-xileno, o-xileno, p-xileno y mezclas de los mismos, cumeno, mezclas de hidrocarburos aromáticos con intervalos de punto de ebullición entre 140 y 320°C conocidos bajo varias marcas comerciales tales como Solvesso®, Shellsol A®, Caromax®, Hydrosol®, portadores parafínicos e isoparafínicos tales como aceites de parafina, aceites minerales, disolventes de hidrocarburos desaromatizados con intervalos de puntos de ebullición entre 50 y 320°C que se conocen por ejemplo bajo la marca comercial Exxsol®, disolventes de hidrocarburos no desaromatizados con intervalos de puntos de ebullición entre 100 y 320°C conocidos con el nombre comercial Varsol®, disolventes isoparafínicos con intervalos de puntos de ebullición entre 100 y 320°C conocidos bajo los nombres comerciales como Isopar® o Shellsol T®, hidrocarburos tal como ciclohexano, tetrahidronaftaleno (tetralina), decahidronaftaleno, alfa-pineno, d-limoneno, hexadecano, iso-octano, disolventes de éster tales como acetato de etilo, acetato de *n*/*i*-butilo, acetato de amilo, acetato de *i*-bornilo, acetato de 2-etilhexilo, ésteres de alquilo de C₆-C₁₈ de ácido acético conocidos bajo el nombre comercial Exxate®, éster etílico de ácido láctico, éster propílico de ácido láctico, éster butílico de ácido láctico, benzoato de bencilo, lactato de bencilo, dibenzoato de dipropilenglicol, ésteres dialquílicos de ácido succínico, maleico y fumárico, y disolventes polares tales como N-metilpirrolidona, N-etilpirrolidona, alquil C₃-C₁₈-pirrolidonas, gamma-butirolactona, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetillactamida, dimetilamidas de ácidos grasos de C₄-C₁₈, dimetilamida de ácido benzoico, acetonitrilo, acetona, metil-etil-cetona, metil-isobutil-cetona, cetona isoamílica, 2-heptanona, ciclohexanona, isoforona, metil-isobutenil-cetona (óxido de mesitilo), acetofenona, carbonato de etileno, carbonato de propileno, carbonato de butileno, disolventes y diluyentes alcohólicos tales como metanol, etanol, propanol, *n*/iso-butanol, *n*/iso-pentanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, 2-metil-2,4-pentanodiol, 4-hidroxi-4-metil-pentanona, ciclohexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, éter butílico de etilenglicol, éter metílico de etilenglicol, dietilenglicol, éter butílico de dietilenglicol, éter etílico de dietilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, éter metílico de dipropilenglicol y otros disolventes de éter de glicol similares basados en materias primas de etilenglicol, propilenglicol y butilenglicol, trietilenglicol, polietilenglicol (PEG 400), polipropilenglicoles con masas moleculares de 400-4000, glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, 1,4-dioxano, abietato de dietilenglicol, clorobenceno, clorotolueno, ésteres de ácidos grasos tales como octanoato de metilo, miristato de isopropilo, laurato de metilo, oleato de metilo, mezclas de ésteres metílicos de ácidos grasos de C₈-C₁₀, ésteres metílico y etílico de aceite de colza, ésteres metílico y etílico de aceite de soja, aceites vegetales, ácidos grasos tales como ácido oleico, ácido linoleico, ácido linolénico, ésteres de ácido fosfórico y fosfónico, tales como fosfato de trietilo, fosfatos de trisálquilo de C₃-C₁₈, fosfato de alquilarilo, fosfonatos de bis-octil-octilo.

El agua es generalmente el vehículo de elección para diluir los concentrados.

Vehículos sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla de pirofilita, sílice (sílice pirolizada o precipitada y opcionalmente funcionarizada o tratada, por ejemplo silabada), arcilla de atapulgita, kieselguhr, piedra caliza, carbonato cálcico, bentonita, montmorillonita cálcica, vainas de semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, cáscaras molidas de nueces, lignina y sustancias parecidas, como se describe, por ejemplo, en el documento EPA CFR 180.1001. (c) y (d). También se pueden usar como vehículos sólidos los fertilizantes en polvo o granulados.

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

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

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

Las composiciones según la invención pueden incluir adicionalmente un aditivo (comúnmente denominado auxiliar) que comprende un aceite mineral, un aceite de origen vegetal o animal, ésteres alquílicos de dichos aceites, o mezclas de dichos aceites y derivados de aceites. La cantidad de aditivo oleoso en la composición según la invención es generalmente de 0,01 a 10%, basada en la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso se puede añadir al tanque de pulverización en la concentración deseada después de que se haya preparado la mezcla de pulverización. Aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de semilla de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado, tal como AMIGO® (Loveland Products Inc.), ésteres de alquilo de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados metílicos, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de buey. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos, esencialmente 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de colza metilado, y también 5% en peso de emulsionantes y agentes modificadores de pH usuales. Aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden los ésteres alquílicos de ácidos grasos de C₈-C₂₂, especialmente los derivados metílicos de ácidos grasos de C₁₂-C₁₈, siendo importantes por ejemplo los ésteres metílicos del ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico. Esos ésteres son conocidos como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de éster metílico de ácido graso preferido es AGNIQUE ME 18 RD-F® (Cognis). Esos y otros derivados oleosos son también conocidos del Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ª edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y acción de los aditivos oleosos se puede mejorar adicionalmente combinándolos con sustancias tensioactivas, tales como tensioactivos no iónicos, aniónicos, catiónicos o anfóteros. En el documento WO 97/34485, páginas 7 y 8, se dan ejemplos de tensioactivos aniónicos, no iónicos, catiónicos o anfóteros adecuados. Las sustancias tensioactivas preferidas son los tensioactivos aniónicos del tipo dodecylbencenosulfonato, especialmente las sales de calcio de los mismos, y también los tensioactivos no iónicos del tipo etoxilato de alcohol graso. Se da preferencia especial a los alcoholes grasos de C₁₂-C₂₂ etoxilados que tienen un grado de etoxilación de 5 a 40. Ejemplos de tensioactivos comercialmente disponibles son los tipos Genapol (Clariant). También se prefieren los tensioactivos de silicona, especialmente heptametiltriloxanos modificados con poli(óxidos de alquilo), que están comercialmente disponibles como, por ejemplo, SILWET L-77®, y también tensioactivos perfluorados. La concentración de las sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total es en general de 1 a 50% en peso. Ejemplos de aditivos oleosos que consisten en mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de los mismos con tensioactivos son TURBOCHARGE®, ADIGOR® (ambos de (Syngenta Crop Protection AG), ACTIPRON® (BP Oil UK Limited), AGRI-DEX® (Helena Chemical Company).

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

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

Además de los aditivos oleosos listados anteriormente, con el fin de potenciar la actividad de las composiciones según la invención, también es posible añadir formulaciones de alquilpirrolidonas (por ejemplo AGRIMAX® de ISP) a la mezcla de pulverización. También se pueden usar formulaciones de látex sintéticos, tales como, por ejemplo, compuestos de poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-p-menteno (por ejemplo BOND®, COURIER® o EMERALD®).

Tales aceites auxiliares como se describen en los párrafos anteriores se pueden emplear como el líquido portador en el que un compuesto activo se disuelve, se emulsiona o se dispersa según sea apropiado para la forma física del compuesto activo.

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

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

Las formulaciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones representativas:

(% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

Ingrediente activo:	1 a 95%, preferiblemente 60 a 90%
Agentes tensioactivos:	1 a 30%, preferiblemente 5 a 20%
Disolventes como vehículo líquido:	1 a 80%, preferiblemente 1 a 35%

Polvos:

Ingrediente activo:	0,1 a 10%, preferiblemente 0,1 a 5%
Vehículos sólidos:	99,9 a 90%, preferiblemente 99,9 a 99%

Concentrados en suspensión:

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

Polvos humectables:

Ingrediente activo:	0,5 a 90%, preferiblemente 1 a 80%
Agentes tensioactivos:	0,5 a 20%, preferiblemente 1 a 15%
Vehículos sólidos:	5 a 95 %, preferiblemente 15 a 90%

Gránulos:

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

Gránulos dispersables en agua:

Ingrediente activo:	1 a 90%, preferiblemente 10 a 80%
Agentes tensioactivos:	0,5 a 80%, preferiblemente 5 a 30%
Vehículos sólidos:	90 a 10%, preferiblemente 70 a 30%

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

F1. Concentrados emulsionables	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5 %	10 %	25 %	50 %
Dodecibencenosulfonato de calcio	6 %	8 %	6 %	8 %
éter poliglicólico de aceite de ricino (36 moles de óxido de etileno)	4 %	-	4 %	4 %
éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	-	4 %	-	2 %
NMP	-	10 %		20 %
Mezcla de hidrocarburos aromáticos de C ₉ -C ₁₂	85 %	68 %	65 %	16 %

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

F2. Disoluciones	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	10 %	50 %	90 %
1-metoxi-3-(3-metoxi-propoxi)-propano	40 %	50 %	-	
Polietilenglicol MW 400	20 %	10 %	-	-
NMP	-		50 %	10 %
Mezcla de hidrocarburos aromáticos de C ₉ -C ₁₂	35 %	30 %	-	-

5 Las disoluciones son adecuadas para aplicación no diluida o tras la dilución en agua.

F3. Polvos humectables	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5 %	25 %	50 %	80 %
Lignosulfonato de sodio	4 %	-	3 %	-
Laurilsulfato sódico	2 %	3 %	-	4 %
Diisobutilnaftalensulfonato sódico	-	6 %	5 %	6 %
Éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	-	1 %	2 %	-
Ácido silícico muy dispersado	1 %	3 %	5 %	10 %
Caolín	88 %	62 %	35 %	-

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

F4. Gránulos revestidos	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1 %	5 %	15 %
silíce muy dispersada	0,9 %	2 %	2 %

ES 2 553 417 T3

Vehículo inorgánico (diámetro 0,1-1 mm)	99,0 %	93 %	83 %
por ejemplo CaCO ₃ o SiO ₂			

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

F5. Gránulos revestidos	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1 %	5 %	15 %
Poliethylenglicol PM 200	1,0 %	2 %	3 %
silice muy dispersada	0,9 %	1 %	2 %
Vehículo inorgánico (diámetro 0,1-1 mm)	98,0 %	92 %	80 %

por ejemplo CaCO₃ o SiO₂

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

F6. Gránulos extruidos	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	0,1 %	3 %	5 %	15 %
Lignosulfonato de sodio	1,5 %	2 %	3 %	4 %
Carboximetilcelulosa	1,4 %	2 %	2 %	2 %
Caolín	97,0 %	93 %	90 %	79 %

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

F7. Gránulos dispersables en agua	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5 %	10 %	40 %	90 %
Lignosulfonato de sodio	20 %	20 %	15 %	7 %
Naftalenosulfonato de dibutilo	5 %	5 %	4 %	2 %
Goma arábica	2 %	1 %	1 %	1 %
Tierra de diatomeas	20 %	30 %	5 %	
Sulfato de sodio		4 %	5 %	
Caolín	48 %	30 %	30 %	

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

F7. Polvos:	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1 %	1 %	5 %
Talco	39,9 %	49 %	35 %
Caolín	60,0 %	50 %	60 %

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

F8. Concentrados en suspensión:	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	3 %	10 %	25 %	50 %
propilenglicol	5 %	5 %	5 %	5 %

nonilfenol poliglicol éter (15 moles de óxido de etileno)	-	1 %	2 %	
lignosulfonato de sodio	3 %	3 %	7 %	6 %
heteropolisacárido (xantana)	0,2 %	0,2 %	0,2 %	0,2 %
1,2-Bencisotiazolin-3-ona	0,1 %	0,1 %	0,1 %	0,1 %
emulsión de aceite de silicona	0,7 %	0,7 %	0,7 %	0,7 %
agua	87 %	79 %	62 %	38 %

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

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

10 El término "cultivos" debe entenderse que incluye también cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO, y HPPD) como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha hecho tolerante por ejemplo a imidazolinonas, tales como imazamox, por métodos convencionales de reproducción es colza de verano (cánola) Clearfield®. Ejemplos de cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas por métodos de ingeniería genética incluyen, por ejemplo, variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®. Las malas hierbas a controlar pueden ser tanto malas hierbas monocotiledóneas como dicotiledóneas, tales como, por ejemplo, Stellaria, Nasturtium, Agrostis, Digitaria, 15 Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola y Veronica. El control de malas hierbas monocotiledóneas, en particular Agrostis, Avena, Setaria, Lolium, Echinochloa, Bromus, Alopecurus y Sorghum, es muy amplio.

20 También se entiende que los cultivos son aquellos que se han hecho resistentes a insectos dañinos por métodos de ingeniería genética, por ejemplo maíz Bt (resistente al taladrador del maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo del algodón) y también patatas Bt (resistentes al escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt-176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína que se forma de manera natural por las bacterias del suelo *Bacillus thuringiensis*. Ejemplos de toxinas y plantas transgénicas que son capaces de sintetizar tales toxinas se describen en los documentos EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, 25 WO 03/052073 y EP-A-427529. Ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y su material de semilla pueden ser resistentes a herbicidas y, al mismo tiempo, también resistentes a la alimentación de los insectos (acontecimientos transgénicos "apilados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de expresar una proteína insecticidamente activa Cry3 mientras que al mismo tiempo son tolerantes al glifosato. Se entiende que el término "cultivos" incluye también cultivos obtenidos como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética y que contienen los así llamados rasgos de producción total (por ejemplo, mejor sabor, estabilidad durante el almacenamiento, contenido nutricional).

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

Los compuestos de fórmula I según la invención también se pueden usar en combinación con otros herbicidas. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de fórmula I es uno de aquellos compuestos enumerados en las Tablas 1 a 58 más abajo. Son especialmente importantes las siguientes mezclas del compuesto de fórmula I:

40 compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfen-sodio, compuesto de fórmula I + aclonifen, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopirralida, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de fórmula I + anilofós, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benazolina, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzfendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafós, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de 50

fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + bórax, compuesto de fórmula I + bromacilo, compuesto de
 fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de
 fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + butamifós, compuesto de fórmula I + butralina, compuesto de
 fórmula I + butoxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto
 5 de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida,
 compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I +
 CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + clorflurenol, compuesto de fórmula I +
 clorflurenol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + clorimurón, compuesto de
 fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón,
 10 compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + clortal,
 compuesto de fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I +
 cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I +
 cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de
 fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de
 15 fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA,
 compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto
 de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de
 fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de
 fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto
 20 de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de
 fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de
 fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I
 + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I
 + orto-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + para-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop,
 25 compuesto de fórmula I + diclorprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-
 metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I +
 metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenican, compuesto de fórmula I + diflufenzopir,
 compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I +
 dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrin, compuesto de fórmula I + dimetenamid, compuesto de
 30 fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de fórmula I + dimetipin, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarsínico,
 compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamid,
 compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I +
 ditiopir, compuesto de fórmula I + diurón, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP,
 compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto
 35 de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfuralin, compuesto de
 fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I +
 etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifeno, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula
 I + etobenzanida, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo,
 compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I +
 40 flamprop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula
 I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop-P, compuesto de
 fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-
 sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloralin, compuesto de fórmula I +
 flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de fórmula I +
 45 flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de
 fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofeno,
 compuesto de fórmula I + fluoroglicofen-etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I +
 flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metilo-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto
 de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto
 50 de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo,
 compuesto de fórmula I + fomesafeno, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I +
 fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amónico, compuesto de
 fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo,
 compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula I + HC-252,
 55 compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I +
 imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de
 fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquin, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de
 fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofan, compuesto de fórmula I + yodometano,
 compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de
 60 fórmula I + yoxinilo, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + isourón, compuesto de
 fórmula I + isoxaben, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de
 fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofeno, compuesto de fórmula I + lenacilo, compuesto de
 fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I +
 MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I +
 65 mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I
 + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto

de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metabenziazurón, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S-metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalina, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazona, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfenol, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamida, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + piperofós, compuesto de fórmula I + arsenito potásico, compuesto de fórmula I + azida potásica, compuesto de fórmula I + pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluzol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraclonilo, compuesto de fórmula I + piraflufeno, compuesto de fórmula I + piraflufeno-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifeno, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piriftalida, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfan, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quinclorac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quinoclamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito de sodio, compuesto de fórmula I + azida sódica, compuesto de fórmula I + clorato de sodio, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio, compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacilo, compuesto de fórmula I + terbumetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de fórmula I + topamezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + tri-alato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético (Nº DE REGISTRO CAS 353292-31-6), compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofen-3-carboxílico (BAY636), compuesto de fórmula I + BAY747 (Nº DE REGISTRO CAS 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topamezona (Nº DE REGISTRO CAS 210631-68-8), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (Nº DE REGISTRO CAS 352010-68-5), y compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

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

Para aplicaciones en cereales, se prefieren particularmente las siguientes mezclas: compuesto de fórmula I + aclonifeno, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopirralida, compuesto de fórmula

- I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfuron, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenican, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + yoxinilo, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + pirasulfotol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piroxasulfona (KIH-485), compuesto de fórmula I + piroxsulam, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + tembotriona, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tiencarbazona, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + tri-alato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + trinexapac-etilo y compuesto de fórmula I + tritosulfurón, en las que se prefieren particularmente las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula (I) + amidosulfurón, compuesto de fórmula (I) + aminopiralida, compuesto de fórmula (I) + beflubutamida, compuesto de fórmula (I) + bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula (I) + clorotolurón, compuesto de fórmula (I) + clorsulfurón, compuesto de fórmula (I) + clodinafop, compuesto de fórmula (I) + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula (I) + clopiralida, 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + difenzoquat, compuesto de fórmula (I) + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula (I) + diflufenicán, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de fórmula (I) + flucarbazona, compuesto de fórmula (I) + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula (I) + flufenacet, compuesto de fórmula (I) + flupirsulfurón, compuesto de fórmula (I) + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula (I) + fluroxipir, compuesto de fórmula (I) + flurtamona, compuesto de fórmula (I) + yodosulfurón, compuesto de fórmula (I) + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mesosulfurón, compuesto de fórmula (I) + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + picolinafeno, compuesto de fórmula (I) + pinoxadeno, compuesto de fórmula (I) + prosulfocarb, compuesto de fórmula (I) + pirasulfotol, compuesto de fórmula (I) + piroxasulfona (KIH-485), compuesto de fórmula (I) + piroxsulam, compuesto de fórmula (I) + sulfosulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + tralkoxidim, compuesto de fórmula (I) + triasulfurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + trifluralina, compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo y compuesto de fórmula (I) + tritosulfurón.
- 50 Los compuestos de fórmula I según la invención también se pueden usar en combinación con protectores de herbicidas. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I es uno de esos compuestos listados en las Tablas 1 a 58 más abajo. Especialmente se toman en consideración las siguientes mezclas con protectores de herbicidas:
- 55 compuesto de fórmula I + cloquintocet-mexilo, compuesto de fórmula I + cloquintocet ácido y sus sales, compuesto de fórmula I + fenclorazol-etilo, compuesto de fórmula I + fenclorazol ácido y sus sales, compuesto de fórmula I + mefenpir-dietilo, compuesto de fórmula I + mefenpir diácido, compuesto de fórmula I + isoxadifen-etilo, compuesto de fórmula I + isoxadifen ácido, compuesto de fórmula I + furilazol, compuesto de fórmula I + isómero R de furilazol, compuesto de fórmula (I) + N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, compuesto de fórmula I + benoxacor, compuesto de fórmula I + diclormida, compuesto de fórmula I + AD-67, compuesto de fórmula I + oxabetrinilo, compuesto de fórmula I + ciometrinilo, compuesto de fórmula I + isómero Z de ciometrinilo, compuesto de fórmula I + fenclorim, compuesto de fórmula I + ciprosulfamida, compuesto de fórmula I + anhídrido naftálico, compuesto de fórmula I + flurazol, compuesto de fórmula I + CL 304,415, compuesto de fórmula I + diclonón, compuesto de fórmula I + fluxofenim, compuesto de fórmula I + DKA-24, compuesto de fórmula I + R-29148 y compuesto de fórmula I + PPG-1292.

También se puede observar un efecto de protección para las mezclas compuesto de la fórmula I + dimron, compuesto de la fórmula I + MCPA, compuesto de la fórmula I + mecoprop y compuesto de la fórmula I + mecoprop-P.

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

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

La tasa de aplicación del protector con respecto al herbicida depende enormemente del modo de aplicación. En el caso del tratamiento del campo, generalmente se aplica de 0,001 a 5,0 kg de protector/ha, preferiblemente de 0,001 a 0,5 kg de protector/ha, y generalmente de 0,001 a 2 kg de herbicida/ha, pero preferiblemente de 0,005 a 1 kg/ha.

15 Las composiciones herbicidas según la invención son adecuadas para todos los métodos de aplicación habituales en agricultura, tales como, por ejemplo, aplicación pre-emergencia, aplicación post-emergencia, y tratamiento de las semillas. Dependiendo del uso pretendido, los protectores se pueden usar para tratar previamente el material de semilla de una planta de cultivo (tratando la semilla o plántulas), o se pueden introducir en el suelo antes o después de la siembra, seguido de la aplicación del compuesto de la fórmula (I) (sin proteger), opcionalmente en combinación con un co-herbicida. Sin embargo, también se pueden aplicar solos o junto con el herbicida, antes o después de la emergencia de las plantas. El tratamiento de las plantas o del material de semilla con el protector puede tener lugar por lo tanto en principio independientemente del momento de aplicación del herbicida. Generalmente se prefiere el tratamiento de la planta mediante aplicación simultánea de herbicida y protector (por ejemplo, en forma de una mezcla de tanque). La tasa de aplicación del protector con respecto al herbicida depende enormemente del modo de aplicación. En el caso del tratamiento del campo, generalmente se aplica de 0,001 a 5,0 kg de protector/ha, preferiblemente de 0,001 a 0,5 kg de protector/ha. En el caso de tratamiento de semillas, generalmente se aplica de 0,001 a 10 g de protector/kg de semilla, preferiblemente de 0,05 a 2 g de protector/kg de semilla. Cuando el protector se aplica en forma líquida, con empapamiento de las semillas, poco tiempo antes de la siembra, es ventajoso usar disoluciones de protector que contengan el ingrediente activo en una concentración de 1 a 10000 ppm, preferiblemente de 100 a 1000 ppm.

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

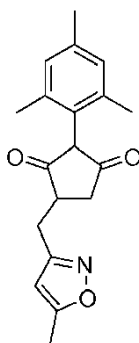
Los siguientes Ejemplos ilustran la invención adicionalmente, pero no limitan la invención.

Ejemplos de preparación:

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

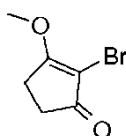
Ejemplo 1:

Preparación de 4-(5-metil-isoxazol-3-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



Etapa 1:

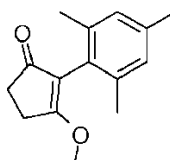
Preparación de 2-bromo-3-metoxi-ciclopent-2-enona



- 5 A una disolución agitada de 3-metoxi-ciclopent-2-enona (14,95 g, 0,133 mmoles) en 1,2-dicloroetano (300 ml) a 0°C en un matraz de color ámbar se añade en porciones *N*-bromosuccinimida (24,92 g, 140 mmoles) durante una hora. La reacción se agita a 0°C durante otros 90 minutos, y después, cualquier sólido que queda se elimina mediante filtración. El filtrado se evapora hasta sequedad a presión reducida, el sólido resultante se disuelve en tolueno caliente (600 ml) y se lava rápidamente con agua (2 x 100 ml). La fase orgánica se evapora a presión reducida hasta
- 10 que aparece un precipitado. El residuo se enfría toda la noche en un refrigerador. El sólido resultante se elimina mediante filtración, se lava con hexano (50 ml) y se seca al aire para dar 15,2 g de 2-bromo-3-metoxi-ciclopent-2-enona como un sólido cristalino blanco.

Etapa 2:

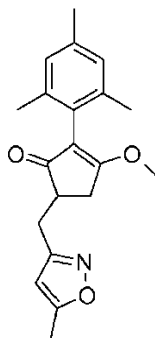
Preparación de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona



- 15 A una suspensión de 2-bromo-3-metoxi-ciclopent-2-enona (32,3 g 169 mmoles), ácido 2,4,6-trimetilfenilborónico (29,5 g, 180 mmoles) y fosfato de potasio recientemente molido (63,7 g) en tolueno desgasificado (800 ml) bajo N₂ se añade Pd(OAc)₂ (896 mg, 8 mmoles) y S-Phos (1,64 g, 4 mmoles), y la reacción se calienta hasta 90°C con agitación bajo N₂ toda la noche. La reacción se reparte entre acetato de etilo (500 ml) y agua (500 ml), y la capa orgánica se elimina, y la fase acuosa se extrae con acetato de etilo (2 x 300 ml). Los extractos orgánicos combinados se evaporan a presión reducida, y el residuo se purifica para dar 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (30,7 g).
- 20

Etapa 3:

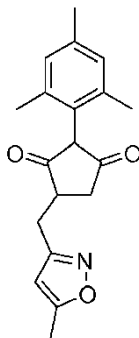
Preparación de 3-metoxi-5-(5-metil-isoxazol-3-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona



25

5 Un matraz se carga con 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (230 mg, 1 mmol), se purga con nitrógeno y se añade THF anhidro (5 ml). La disolución resultante se enfría hasta -78°C , y se añade gota a gota diisopropilamido de litio (disolución 1,8M en hexano/THF/etilbenceno) (0,61 ml, 1,1 mmoles), y la reacción se agita a -78°C durante otros 30 minutos. Se añade entonces en una porción una disolución de 3-clorometil-5-metilisoxazol en THF (1 ml), y la reacción se deja calentar hasta la temperatura ambiente y se agita durante otras 2 horas. La reacción se paraliza mediante adición de disolución saturada de cloruro de amonio (20 ml), y se extrae con acetato de etilo (2 x 20 ml). Los orgánicos combinados se evaporan a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía ultrarrápida para dar 3-metoxi-5-(5-metil-isoxazol-3-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (132 mg).

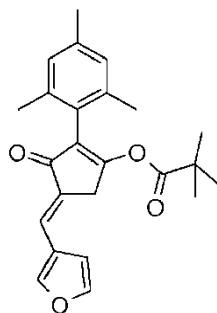
10 Preparación de 4-(5-metil-isoxazol-3-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



15 A una disolución de 3-metoxi-5-(5-metil-isoxazol-3-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (120 mg) en acetona (1 ml) en un vial de microondas se añade HCl 2N (0,6 ml), y la disolución resultante se calienta hasta 130°C mediante irradiación de microondas, con agitación, durante 30 minutos. El disolvente se elimina a presión reducida, y el residuo se tritura con hexano para dar un sólido blanco, que se filtra y se lava bien con hexano para dar 4-(5-metil-isoxazol-3-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona.

Ejemplo 2:

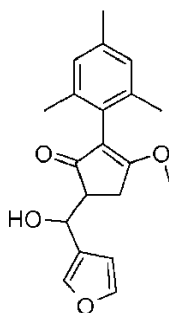
Preparación de éster 4-[1-furan-3-il-met-(E)-iliden]-3-oxo-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido 2,2-dimetil-propiónico



20

Etapa 1:

Preparación de 5-(furan-3-il-hidroxi-metil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona

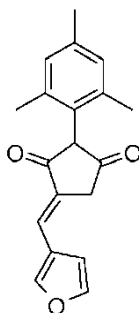


25 A una disolución de diisopropilamina (527 μl) en THF (5 ml) en nitrógeno a -78°C se añade, gota a gota, butil-litio, disolución 2,5M en hexano (1,32 ml), y la reacción se deja agitar a -78°C durante 20 minutos. Esta disolución se añade entonces gota a gota a una disolución de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (691 mg) en THF

- 5 (5 ml) en nitrógeno a -78°C , y la disolución resultante se deja agitar durante otros 30 minutos. Se añade entonces en una porción una disolución de 3-furaldehído (377 mg) en THF (1 ml), y la reacción se deja calentar hasta la temperatura ambiente y se agita durante otros 30 minutos. La reacción se paraliza mediante adición de cloruro de amonio saturado (50 ml) y se extrae con acetato de etilo (50 ml). La capa orgánica se elimina y se purifica mediante cromatografía ultrarrápida automatizada para dar 5-(furan-3-il-hidroxi-metil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (784 mg)

Etapa 2:

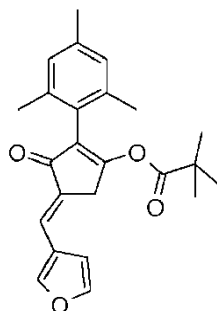
Preparación de 4-[1-furan-3-il-met-(E)-iliden]-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



- 10 A una disolución de 5-(furan-3-il-hidroxi-metil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (770 mg) en acetona (2 ml) se añade ácido clorhídrico 2N (2 ml), y la suspensión resultante se calienta hasta 120°C durante 30 minutos. La mezcla de reacción bruta se concentra *a vacío* y se purifica mediante cromatografía ultrarrápida para dar 4-[1-furan-3-il-met-(E)-iliden]-2-(2,4,6-trimetilfenil)-ciclopentano-1,3-diona.

Etapa 3:

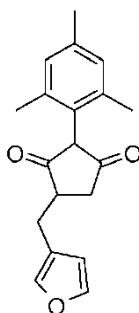
- 15 Preparación de éster 4-[1-furan-3-il-met-(E)-iliden]-3-oxo-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido 2,2-dimetil-propiónico



- 20 A una disolución de 4-[1-furan-3-il-met-(E)-iliden]-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (50 mg) en diclorometano (2 ml) se añade trietilamina (118 μl), seguido de cloruro de trimetilacetilo (105 μl), y la suspensión resultante se deja agitar a temperatura ambiente durante 3 horas. La mezcla de reacción bruta se purifica entonces mediante cromatografía ultrarrápida automatizada para dar éster 4-[1-furan-3-il-met-(E)-iliden]-3-oxo-2-(2,4,6-trimetilfenil)-ciclopent-1-enílico del ácido 2,2-dimetil-propiónico.

Ejemplo 3:

Preparación de 4-furan-3-ilmetil-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



25

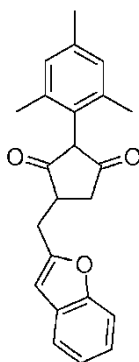
Etapa 1:

Preparación de 4-furan-3-ilmetil-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona

5 A una disolución de 4-[1-furan-3-il-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (167 mg) en etanol (5 ml) se añade paladio al 5% sobre carbón (15 mg), y la suspensión resultante se agita bajo una atmósfera de hidrógeno (3 bares) durante 5 horas. La reacción se filtra a través de una almohadilla de Celite, se lava con metanol, y el filtrado se purifica mediante cromatografía ultrarrápida automatizada para dar 4-furan-3-ilmetil-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona.

Ejemplo 4:

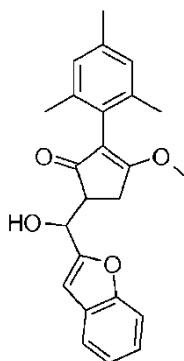
Preparación de 4-benzofuran-2-ilmetil-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



10

Etapa 1:

Preparación de 5-(benzofuran-2-il-hidroxi-metil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona

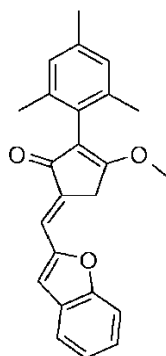


15 Un matraz se carga con 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (691 mg, 3 mmoles), se purga con nitrógeno y se añade THF anhidro (10 ml). La disolución resultante se enfría hasta -78°C , y se añade gota a gota diisopropilamido de litio (disolución 1,8M en hexano/THF/etilbenceno) (1,83 ml, 3,3 mmoles), y la reacción se agita a -78°C durante otros 30 minutos. Se añade entonces en una porción una disolución de 2-benzofuraldehído (400 μl , 3,3 mmoles) en THF (1 ml), y la reacción se deja calentar hasta la temperatura ambiente y se agita durante otras 2 horas. La reacción se paraliza mediante adición de disolución saturada de cloruro de amonio (60 ml), y se extrae con acetato de etilo (2 x 60 ml). Los orgánicos combinados se evaporan a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía ultrarrápida para dar 5-(benzofuran-2-il-hidroxi-metil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (1,11 g)

20

Etapa 2:

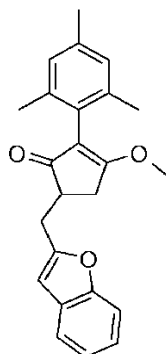
Preparación de 5-[1-benzofuran-2-il-met-(*E*)-iliden]-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona



5 A una disolución de 5-(benzofuran-2-ylhidroxi-metil)-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (1,11 g) en metanol (10 ml) se añade carbonato de potasio (476 mg), seguido de yoduro de metilo (214 μ l), y la suspensión resultante se calienta a reflujo durante 17 horas. La mezcla de reacción bruta se concentra entonces *a vacío* y se reparte entre acetato de etilo (50 ml) y agua (50 ml), y la capa orgánica se purifica mediante cromatografía ultrarrápida automatizada para dar 5-[1-benzofuran-2-ylmet-(*E*)-iliden]-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (337 mg).

Etapa 3:

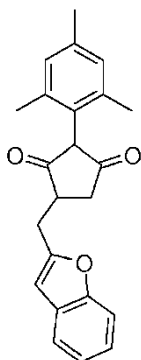
Preparación de 5-benzofuran-2-ylmetil-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona



10 A una disolución de 5-[1-benzofuran-2-ylmet-(*E*)-iliden]-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (318 mg) en etanol (10 ml) se añade paladio al 10% sobre carbón (32 mg), y la suspensión resultante se agita bajo una atmósfera de hidrógeno (4 bares) durante 5 horas. La reacción se filtra a través de una almohadilla de Celite, se lava con metanol, y el filtrado se concentra *a vacío* para dar 5-benzofuran-2-ylmetil-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (315 mg).

Etapa 4:

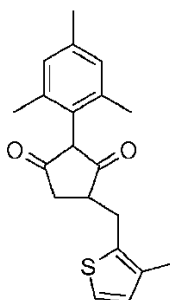
Preparación de 4-benzofuran-2-ylmetil-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



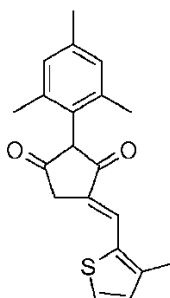
20 A una disolución de 5-benzofuran-2-ylmetil-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (298 mg) en acetona (2 ml) se añade HCl 2N, y la suspensión resultante se calienta hasta 50°C durante 5 horas. La reacción se diluye entonces con HCl 2N (50 ml) y se extrae con acetato de etilo (50 ml), y la capa orgánica se elimina, se seca sobre sulfato de magnesio, y se concentra *a vacío* para dar 4-benzofuran-2-ylmetil-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona.

Ejemplo 5:

Preparación de 4-(3-metiltiofen-2-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentano-1,3-diona



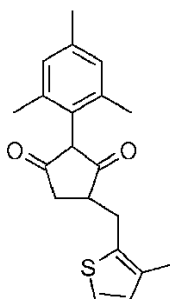
Etapa 1:

5 Preparación de 4-[1-(3-metiltiofen-2-il)-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentano-1,3-diona

10 Se añade terc-butóxido de potasio (0,53 g, 4,72 mmoles) a una disolución fría de una mezcla de 3-metoxi-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopent-2-enona (0,5 g, 2,16 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml). La mezcla de reacción se agita durante 30 minutos a 0°C, y a esta mezcla se añade una disolución de 3-metil-2-tiofencarboxaldehído (0,23 g, 1,82 mmoles) en tetrahidrofurano (1 ml). La mezcla de reacción se agita a 0°C durante 2 horas, se acidifica hasta pH 1 con ácido clorhídrico acuoso 2N, y la fase acuosa se extrae con acetato de etilo (3 x 25 ml), las fases orgánicas se combinan, se lavan con agua, y se secan sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla se filtra, y el filtrado se evapora a presión reducida para dar un residuo bruto. El residuo bruto se disuelve en acetona (6 ml), se añade ácido clorhídrico concentrado (3 ml), y la disolución resultante se calienta hasta 60°C durante 8 h. La mezcla de reacción se diluye con agua y se extrae con acetato de etilo (3 x 25 ml). Los orgánicos combinados se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de sodio, se filtran, y se concentran a vacío para dar un residuo. Este residuo se purifica entonces usando cromatografía en columna en gel de sílice para dar 4-[1-(3-metiltiofen-2-il)-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentano-1,3-diona (100 mg).

Etapa 2:

20 Preparación de 4-(3-metiltiofen-2-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentano-1,3-diona



25 Una disolución de 4-[1-(3-metiltiofen-2-il)-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentano-1,3-diona (100 mg, 0,31 mmoles) en metanol (10 ml) se hidrogena en un H-Cube usando paladio al 10% sobre carbón a 40°C y presión de 10 bares de hidrógeno con un caudal de 0,5 ml/min. El eluato recogido se concentra a vacío para dar un residuo que se purifica mediante cromatografía en columna en gel de sílice para dar 4-(3-metiltiofen-2-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetilfenil)ciclopentano-1,3-diona.

Compuestos adicionales en la Tabla T1 y P1 más abajo se prepararon mediante métodos similares usando materiales de partida apropiados.

ES 2 553 417 T3

Cuando se observa más de un tautómero o confórmero rotacional en el espectro de RMN protónica, los datos mostrados más abajo son para la mezcla de isómeros y confórmeros.

Excepto que se señale de otro modo, los espectros de RMN protónica se registraron a temperatura ambiente.

5 Los compuestos caracterizados mediante HPLC-MS se analizaron usando uno de los tres métodos descritos más abajo.

Método A

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

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

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

Método B

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

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

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

Método C

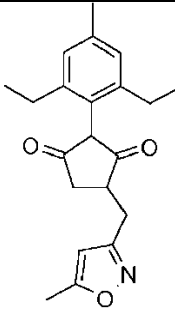
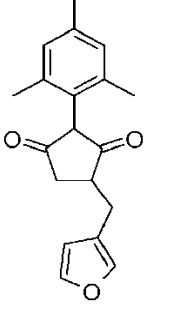
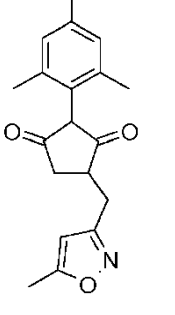
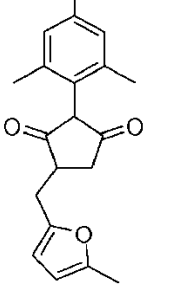
20 Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando un Thermo Finnigan Surveyor MSQ Plus equipado con una columna Waters Xterra RP-18 (longitud de la columna 50 mm, diámetro interno de la columna 4,6 mm, tamaño de partículas 3,5 micrómetros, temperatura 30°C), un conjunto de fotodiodos Surveyor Plus. El análisis se llevó a cabo usando un tiempo de experimentación de seis minutos, según la siguiente tabla de gradientes:

Tiempo (min.)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	90,0	10,0	1,30

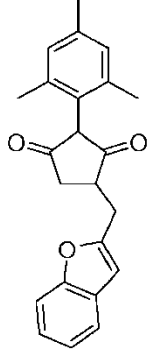
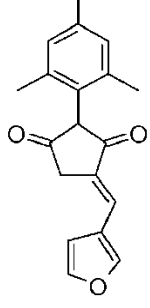
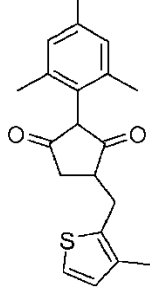
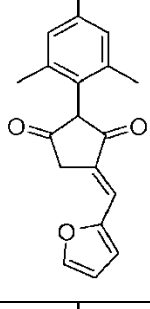
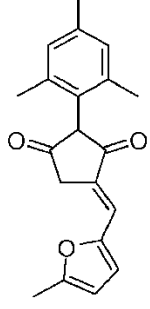
ES 2 553 417 T3

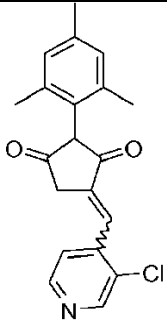
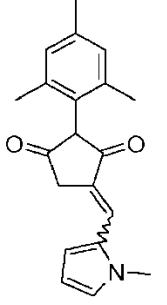
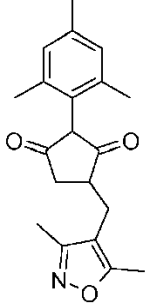
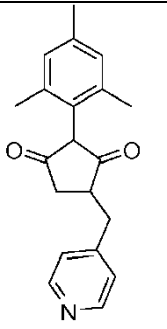
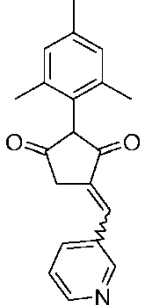
3,80	0,00	100	1,30
4,80	0,00	100	1,30
5,00	90,0	10,0	1,30
6,00	90,0	10,0	1,30
Disolvente A: H ₂ O con 0,05% de HCOOH			
Disolvente B: CH ₃ CN con 0,05% de HCOOH			

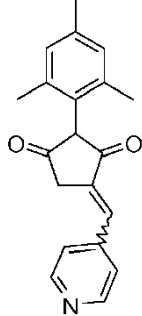
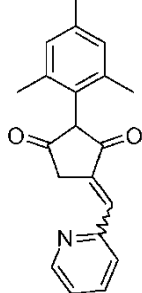
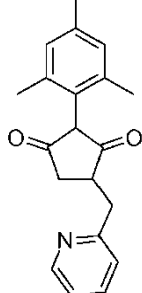
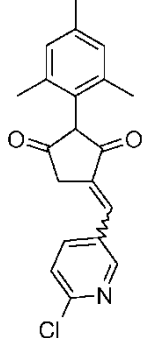
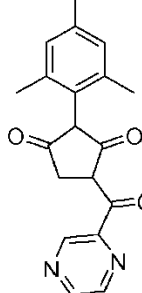
Tabla T1

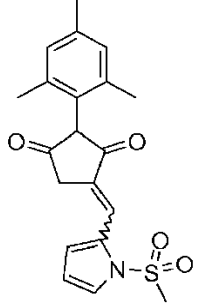
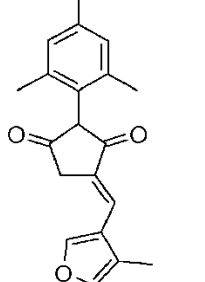
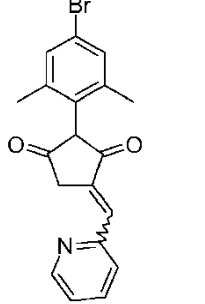
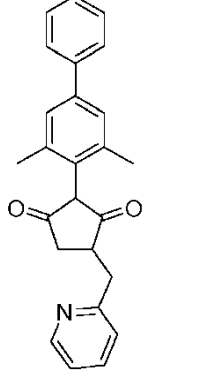
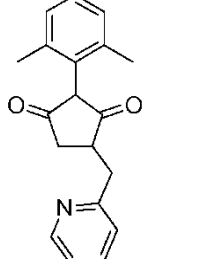
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es seña) u otro dato físico
T1		δ ppm 1,02-1,12 (m, 6H), 2,21-2,46 (m, 10H), 2,55-3,55 (m, 5H), 5,88-5,97 (m, 1H), 6,89-6,98 (m, 2H), 10,12 (s, 1H)
T2		δ ppm 1,94 (s, 3H) 2,09 (s, 3H) 2,27 (s, 3H) 2,45 (d, 1H) 2,71 - 2,85 (m, 3H) 2,99 (dd, 1H) 6,31 (s, 1H) 6,91 (d, 2H) 7,29 (s, 1H) 7,36 (s, 1H)
T3		δ ppm 1,84 - 2,15 (m, 6H) 2,22 - 2,42 (m, 7H) 2,91 - 3,19 (m, 3H) 3,13 - 3,49 (m, 1H) 5,82 - 6,6.98 (m, 1H) 6,82 - 6,91 (m, 2H) 10,22 (s, 1H)
T4		δ ppm 1,98 (s, 3H) 2,07 (s, 3H) 2,24 (s, 3H) 2,27 (s, 3H) 2,52 - 2,63 (m, 1H) 2,73 - 2,89 (m, 2H) 3,05 - 3,12 (m, 1H) 3,16 (dd, 1H) 5,85 (d, 1H) 5,95 (d, 1H) 6,89 (d, 2H)

ES 2 553 417 T3

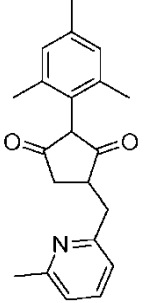
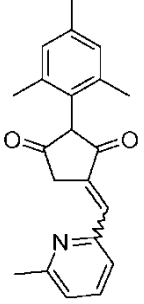
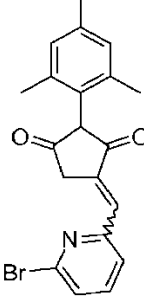
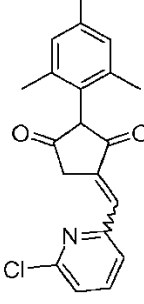
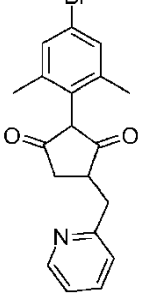
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato fisico
T5		<p>δ ppm 1,92 (s, 3H) 2,08 (s, 3H) 2,26 (s, 3H) 2,61 - 2,67 (m, 1H) 2,84 (dd, 1H) 2,96 - 3,09 (m, 2H) 3,38 (dd, 1H) 6,48 (s, 1H) 6,89 (d, 2H) 7,16 - 7,26 (m, 2H) 7,39 (d, 1H) 7,49 (d, 1H)</p>
T6		<p>δ ppm 2,11 (s, 3H) 2,15 (s, 6H) 3,37 (s, 2H) 6,60 (s, 1H) 6,92 - 6,98 (m, 3H) 7,47 (s, 1H) 7,64 (s, 1H)</p>
T7		<p>δ ppm 1,9 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,2 (s, 3H), 2,5 (dd, 1H), 2,8 (dd, 2H), 3,03 (m, 2H), 3,3 (s, 3H), 6,78 (d, 1H), 6,83 (s, 1H), 6,85 (d, 2H), 7,10 (d, 1H)</p>
T8		<p>δ ppm 2,12 (s, 6H) 2,30 (s, 3H) 3,50 (d, 2H) 6,85 (s, 1H) 6,95 (m, 3H) 7,37 (d, 1H) 7,53 (d, 1H)</p>
T9		<p>δ ppm 2,12 (s, 6H) 2,29 (s, 3H) 2,36 (s, 3H) 3,49 (d, 2H) 6,09 (d, 1H) 6,43 (d, 1H) 6,78 (s, 1H) 6,94 (s, 2H)</p>

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato fisico
T10		LC-MS (Método C) ES ⁻ : 340, 338 (M-H) ⁻ . rt = 5,09 minutos
T11		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 306. rt = 3,92 minutos
T12		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 326. rt = 3,53 minutos
T13		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 308. rt = 2,42 minutos
T14		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 306. rt = 2,94 minutos

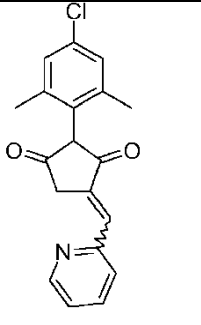
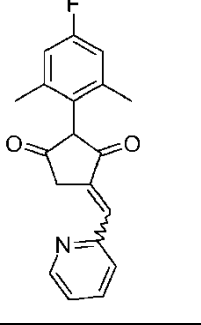
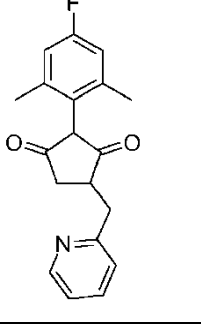
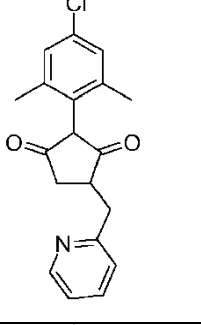
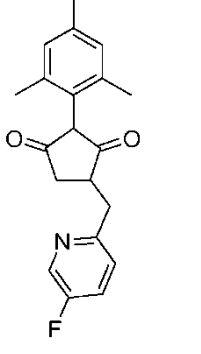
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T15		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 306. rt = 2,56 minutos
T16		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 306. rt = 3,24 minutos
T17		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 308. rt = 2,96 minutos
T18		LC-MS (Método C) ES ⁻ : 340, 338 (M-H) ⁻ . rt = 3,98 minutos
T19		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 321. rt = 4,02 minutos

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T20		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 371. rt = 3,86 minutos
T21		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 309 r.t. = 1,63m
T22		LC-MS (Método C) ES ⁺ : 372, 370 (M+H) ⁺ rt = 3,41 minutos
T23		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 370. rt = 3,59 minutos
T24		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 294. rt = 2,58 minutos

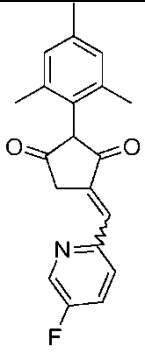
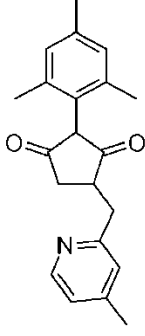
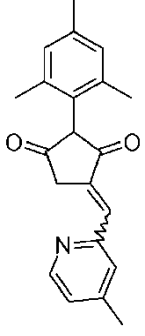
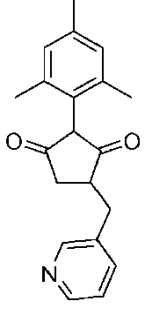
ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T25		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 320. rt = 2,81 minutos
T26		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 320. rt = 2,75 minutos
T27		LC-MS (Método C) ES ⁻ : 384, 382 (M-H) ⁻ . rt = 4,37 minutos
T28		LC-MS (Método C) ES ⁻ : 340, 338 (M-H) ⁻ . rt = 4,27 minutos
T29		LC-MS (Método C) ES ⁺ : 374, 372 (M+H) ⁺ rt = 3,2 minutos

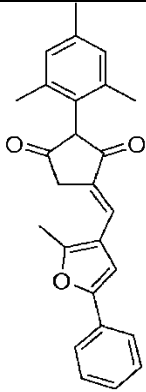
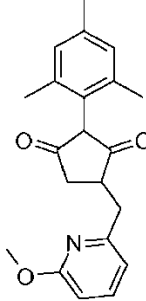
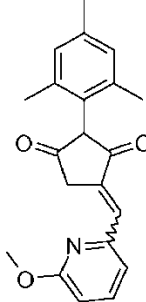
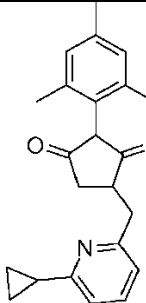
ES 2 553 417 T3

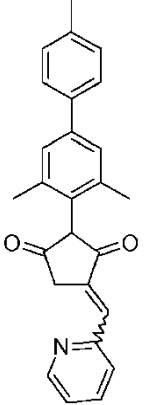
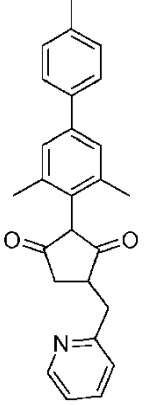
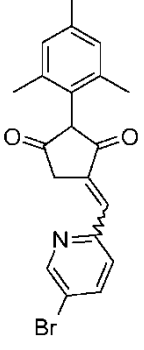
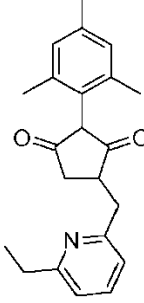
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato fisico
T30		LC-MS (Método C) ES ⁻ : 326, 324 (M-H) ⁻ . rt= 3,26 & 3,91 minutos
T31		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 310. rt=2,88&3,66 minutos
T32		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 312. rt = 2,72 minutos
T33		LC-MS (Método C) ES ⁻ : 328, 326 (M-H) ⁻ . rt = 3,03 minutos
T34		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 326. rt = 3,71 minutos

ES 2 553 417 T3

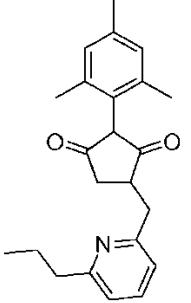
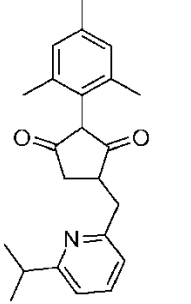
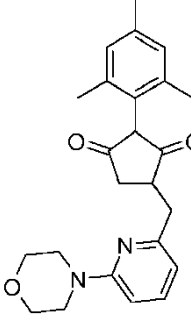
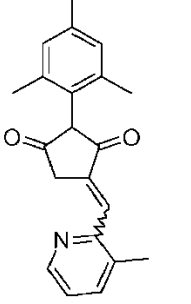
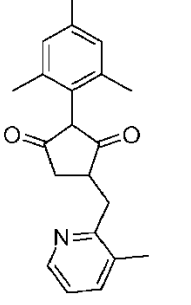
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T35		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 324. rt = 4,01 minutos
T36		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 322. rt = 2,78 minutos
T37		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 320. rt= 2,84 & 3,91 minutos
T38		δ ppm (CD ₃ OD) 1,92 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,45 (dd, 1H), 2,85 (dd, 1H), 3,10 (dd, 1H), 3,20 (m, 1H), 3,30 (dd, 1H), 6,85 (s, 1H), 6,87 (s, 1H), 7,92 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,68 (d, 1H), 8,76 (s, 1H)

ES 2 553 417 T3

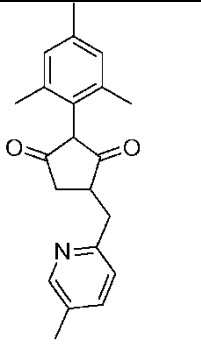
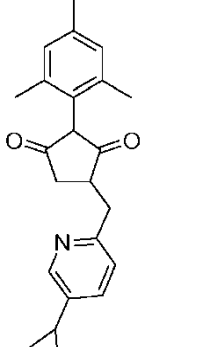
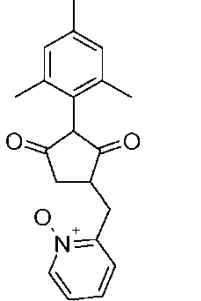
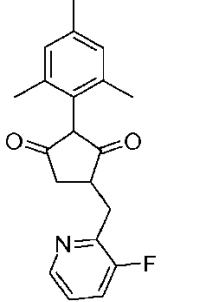
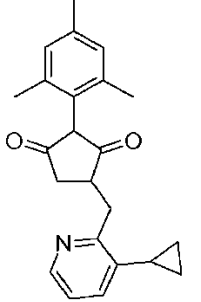
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T39		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 385 r.t. = 1,91 m
T40		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 336. rt = 3,86 minutos
T41		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 336. rt = 4,12 & 4,24 minutos
T42		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 346. rt = 3,46 minutos

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T43		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 382. rt = 4,33 minutos
T44		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 384. rt = 3,65 minutos
T45		LC-MS (Método C) ES ⁺ : 386, 384 (M+H) ⁺ rt = 4,36 minutos
T46		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 336. rt = 3,21 minutos

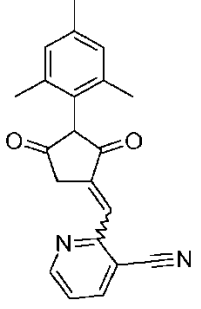
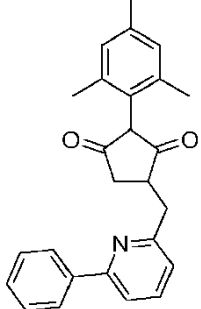
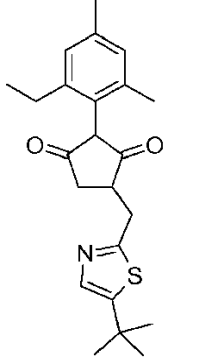
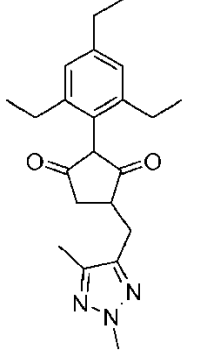
ES 2 553 417 T3

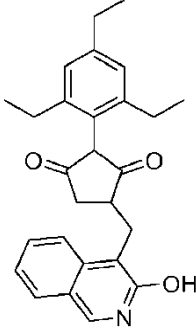
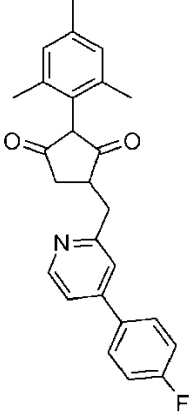
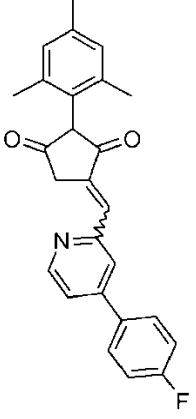
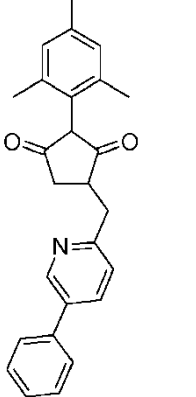
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T47		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 350. rt = 3,43 minutos
T48		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 350. rt = 3,51 minutos
T49		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 393. rt = 3,15 minutos
T50		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 320. rt = 3,46 minutos
T51		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 322. rt = 3,05 minutos

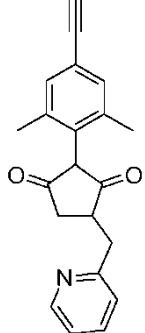
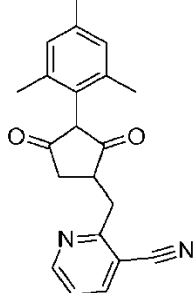
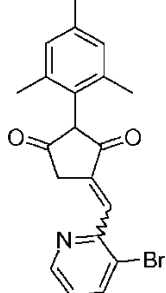
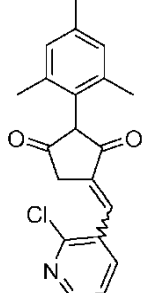
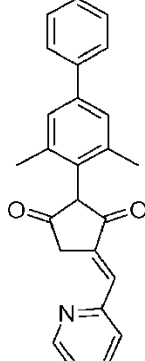
ES 2 553 417 T3

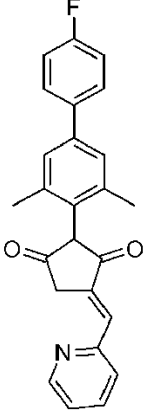
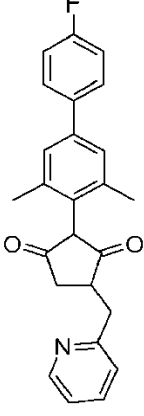
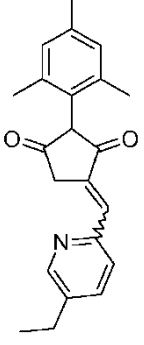
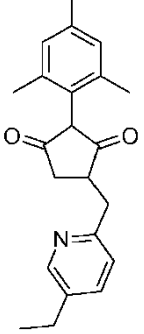
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T52		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 322. rt = 2,94 minutos
T53		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 348. rt = 3,34 minutos
T54		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 324. rt = 2,99 minutos
T55		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 326. rt = 3,68 minutos
T56		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 348. rt = 3,33 minutos

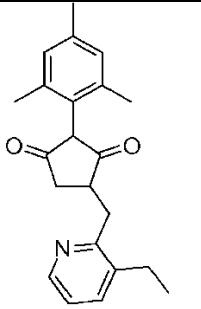
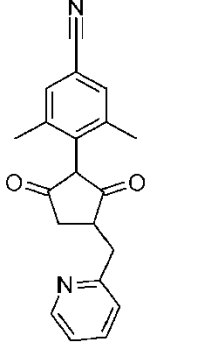
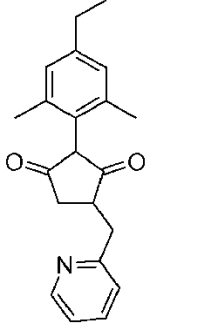
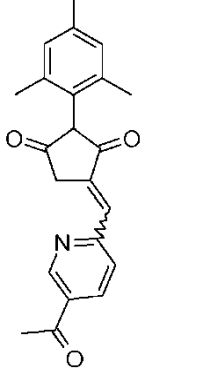
ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T57		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 331. rt = 4,03 minutos
T58		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 384. rt = 4,17 minutos
T59		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 384. rt = 1,80 minutos
T60		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 368. rt = 1,51 minutos

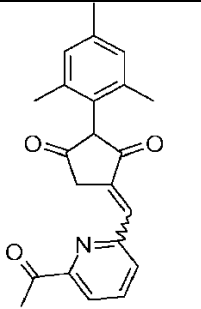
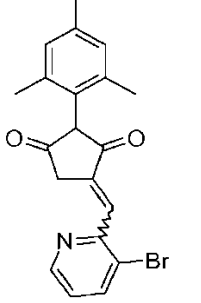
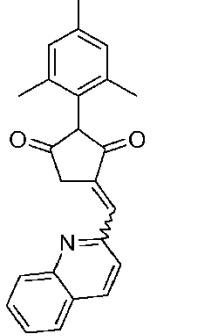
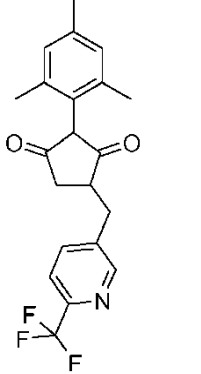
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T61		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 416. rt = 1,61 minutos
T62		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 402. rt = 3,81 minutos
T63		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 400. rt = 4,48 minutos
T64		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 384. rt = 3,99 minutos

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato fisico
T65		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 318. rt = 2,98 minutos
T66		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 333. rt = 3,56 minutos
T67		LC-MS (Método C) ES ⁺ : 386, 384 (M+H) ⁺ rt= 4,22 & 4,33 minutos
T68		LC-MS (Método C) ES ⁺ : 340, 338 (M-H) ⁻ . rt = 3,93 minutos
T69		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 368. rt = 3,87 minutos

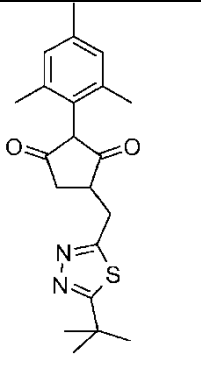
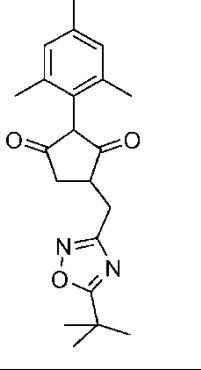
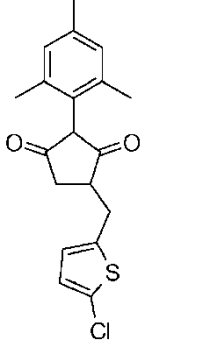
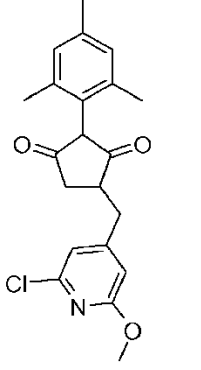
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T70		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 386. rt = 3,86 minutos
T71		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 388. rt = 3,59 minutos
T72		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 334. rt = 3,39 minutos
T73		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 336. rt = 3,16 minutos

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T74		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 336. rt = 3,37 minutos
T75		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 319. rt = 2,49 minutos
T76		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 322. rt = 3,08 minutos
T77		LC-MS (Método C) ES ⁻ : (M-H) ⁻ = 346. rt = 3,78 minutos

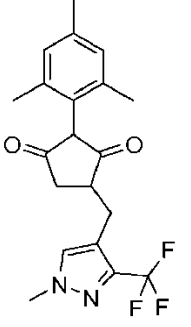
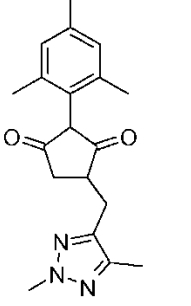
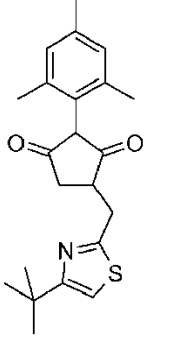
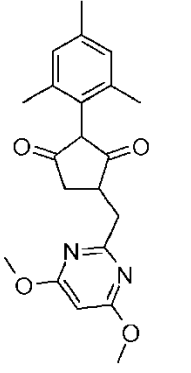
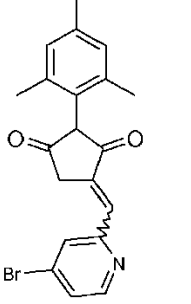
ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T78		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 348.</p> <p>rt = 3,83 minutos</p>
T79		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 386.</p> <p>rt=4,22&4,33 minutos</p>
T80		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 356.</p> <p>rt = 3,99 minutos</p>
T81		<p>LC-MS (Método B) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 376.</p> <p>rt = 1,44 minutos</p>

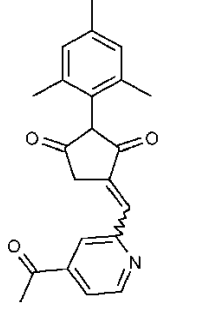
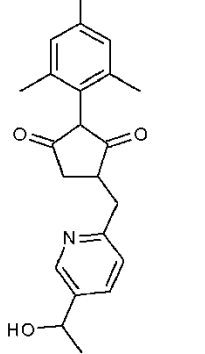
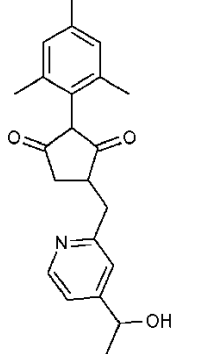
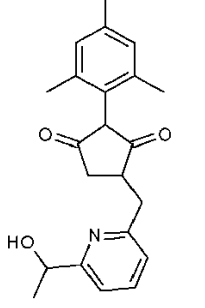
ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T82		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 371. rt = 1,41 minutos
T83		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 355. rt = 1,46 minutos
T84		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 347, 349. rt = 1,58 minutos
T85		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 372, 374. rt = 1,54 minutos

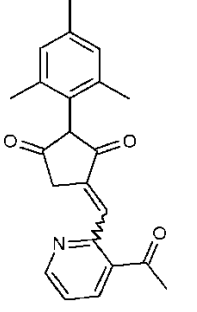
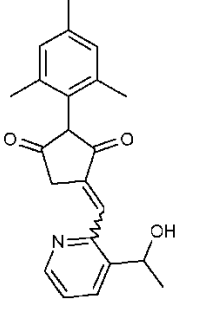
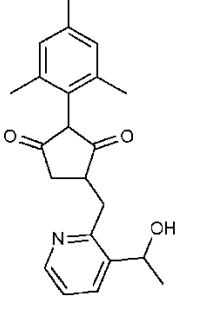
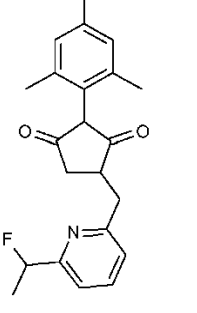
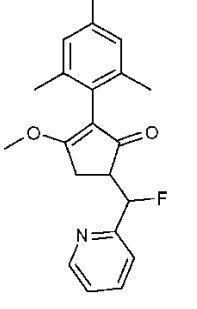
ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato fisico
T86		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 379. rt = 1,42 minutos
T87		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 326. rt = 1,19 minutos
T88		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 370. rt = 1,65 minutos
T89		LC-MS (Método B) ES ⁺ : MH ⁺ = 369. rt = 1,52 minutos
T90		LC-MS (Método C) ES ⁺ : 386, 384 (M+H) ⁺ rt = 4,24 minutos

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T91		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 348.</p> <p>rt = 3,83 minutos</p>
T92		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 352.</p> <p>rt = 2,8 minutos</p>
T93		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 352.</p> <p>rt = 2,69 minutos</p>
T94		<p>LC-MS (Método C) ES⁺:</p> <p>MH⁺ = 352.</p> <p>rt = 3,02 minutos</p>

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato fisico
T95		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 348. rt = 3,8 minutos
T96		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 350. rt= 3,13 & 3,59 minutos
T97		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 352. rt=2,89&3,00 minutos
T98		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 354. rt = 3,83 minutos
T99		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 340. rt = 3,9 minutos

ES 2 553 417 T3

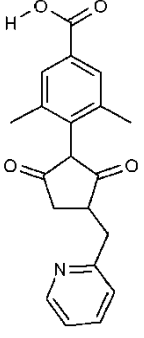
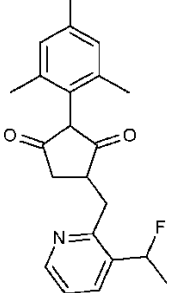
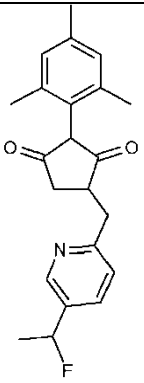
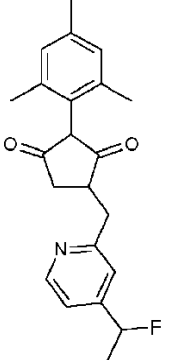
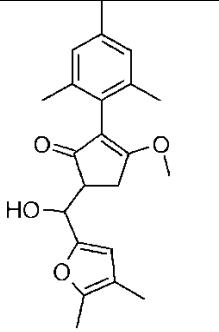
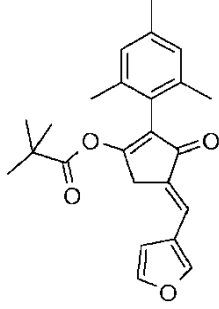
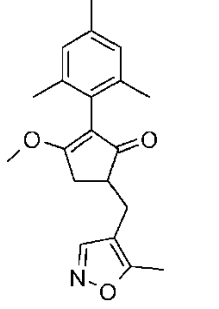
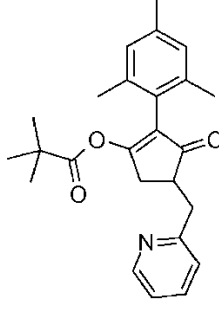
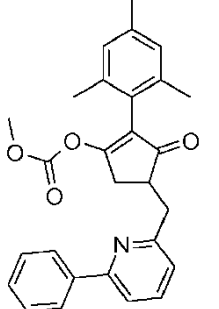
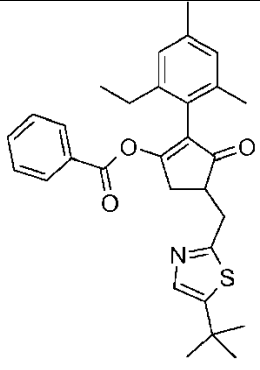
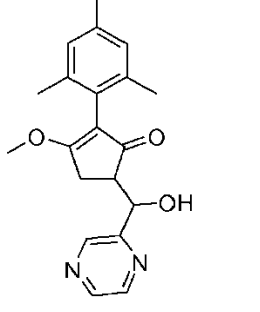
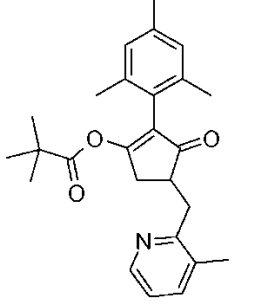
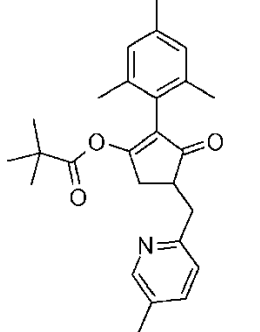
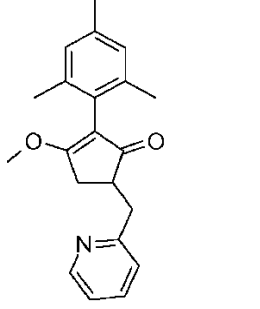
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
T100		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 338. rt = 2,14 minutos
T101		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 354. rt = 3,74 minutos
T102		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 354. rt = 3,64 minutos
T103		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 354. rt = 3,49 minutos

Tabla P1

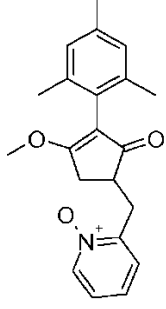
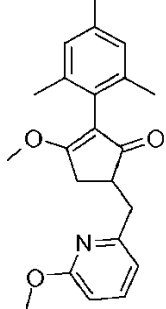
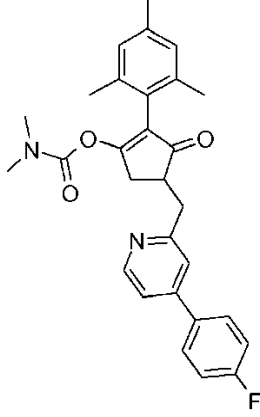
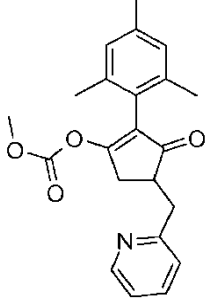
Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
------------------	------------	---

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P1		<p>δ ppm 1,92 (s, 3H) 2,05 (s, 3H) 2,10 (s, 3H) 2,20 (s, 3H) 2,26 (s, 3H) 2,45 (dd, 1H) 2,82 (dd, 1H) 3,17 (ddd, 1H) 4,71 (d, 1H) 4,95 (s, 1H) 6,12 (s, 1H) 6,87 (s, 2H)</p>
P2		<p>δ ppm 1,12 (s, 9H), 2,09 (s, 6H) 2,26 (s, 3H) 3,81 (s, 2H) 6,62 (s, 1H) 6,83 (s, 2H) 7,41 (s, 1H) 7,52 (s, 1H) 7,78 (s, 1H)</p>
P3		<p>LC-MS (Método A) ES⁺: MH⁺ = 326 r.t. = 1,54m</p>
P4		<p>LC-MS (Método C) ES⁺: MH⁺ = 392. rt = 3,71 minutos</p>
P5		<p>LC-MS (Método C) ES⁺: MH⁺ = 442. rt = 4,54 minutos</p>

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P6		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 488. rt = 2,23 minutos
P7		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 339. rt = 3,24 minutos
P8		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 406. rt = 3,64 minutos
P9		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 406. rt = 3,61 minutos
P10		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 322. rt = 2,84 minutos

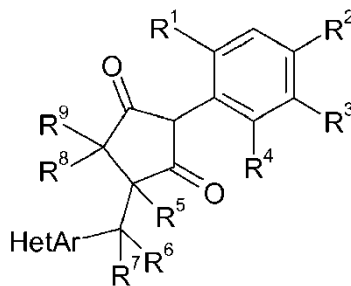
ES 2 553 417 T3

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P11		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 338. rt = 3,17 minutos
P12		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 352. rt = 4,26 minutos
P13		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 473. rt = 3,73 minutos
P14		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 366. rt = 3,09 minutos

Compuesto número	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P15		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 406. rt = 3,35 minutos
P16		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 350. rt = 4,59 minutos

Los compuestos de las siguientes Tablas 1 a 58 se pueden obtener de una manera análoga.

La Tabla 1 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1:



T-1

- 5 en los que R¹ y R³ son metilo, y R² y R⁴ son hidrógeno, y en los que R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la tabla a continuación:

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1	H	H	H	H	H	2-piridilo
2	H	H	H	H	H	3-fluoro-2-piridilo
3	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-piridilo
4	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-piridilo
5	H	H	H	H	H	6-fluoro-2-piridilo
6	H	H	H	H	H	3-cloro-2-piridilo
7	H	H	H	H	H	4-cloro-2-piridilo
8	H	H	H	H	H	5-cloro-2-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
9	H	H	H	H	H	6-cloro-2-piridilo
10	H	H	H	H	H	3-metil-2-piridilo
11	H	H	H	H	H	4-metil-2-piridilo
12	H	H	H	H	H	5-metil-2-piridilo
13	H	H	H	H	H	6-metil-2-piridilo
14	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-2-piridilo
15	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-piridilo
16	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-piridilo
17	H	H	H	H	H	6-trifluorometil-2-piridilo
18	H	H	H	H	H	3-metoxi-2-piridilo
19	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-piridilo
20	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-piridilo
21	H	H	H	H	H	6-metoxi-2-piridilo
22	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-piridilo
23	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-piridilo
24	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-piridilo
25	H	H	H	H	H	6-trifluorometoxi-2-piridilo
26	H	H	H	H	H	3-ciano-2-piridilo
27	H	H	H	H	H	4-ciano-2-piridilo
28	H	H	H	H	H	5-ciano-2-piridilo
29	H	H	H	H	H	6-ciano-2-piridilo
30	H	H	H	H	H	3-nitro-2-piridilo
31	H	H	H	H	H	4-nitro-2-piridilo
32	H	H	H	H	H	5-nitro-2-piridilo
33	H	H	H	H	H	6-nitro-2-piridilo
34	H	H	H	H	H	3-metanosulfonil-2-piridilo
35	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-piridilo
36	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-piridilo
37	H	H	H	H	H	6-metanosulfonil-2-piridilo
38	H	H	H	H	H	3-piridilo
39	H	H	H	H	H	2-fluoro-3-piridilo
40	H	H	H	H	H	4-fluoro-3-piridilo
41	H	H	H	H	H	5-fluoro-3-piridilo
42	H	H	H	H	H	6-fluoro-3-piridilo
43	H	H	H	H	H	2-cloro-3-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
44	H	H	H	H	H	4-cloro-3-piridilo
45	H	H	H	H	H	5-cloro-3-piridilo
46	H	H	H	H	H	6-cloro-3-piridilo
47	H	H	H	H	H	2-bromo-3-piridilo
48	H	H	H	H	H	4-bromo-3-piridilo
49	H	H	H	H	H	5-bromo-3-piridilo
50	H	H	H	H	H	6-bromo-3-piridilo
51	H	H	H	H	H	2-metoxi-3-piridilo
52	H	H	H	H	H	4-metoxi-3-piridilo
53	H	H	H	H	H	5-metoxi-3-piridilo
54	H	H	H	H	H	6-metoxi-3-piridilo
55	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-piridilo
56	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-3-piridilo
57	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-piridilo
58	H	H	H	H	H	6-trifluorometoxi-3-piridilo
59	H	H	H	H	H	2-metil-3-piridilo
60	H	H	H	H	H	4-metil-3-piridilo
61	H	H	H	H	H	5-metil-3-piridilo
62	H	H	H	H	H	6-metil-3-piridilo
63	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-3-piridilo
64	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-3-piridilo
65	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-3-piridilo
66	H	H	H	H	H	6-trifluorometil-3-piridilo
67	H	H	H	H	H	2-ciano-3-piridilo
68	H	H	H	H	H	4-ciano-3-piridilo
69	H	H	H	H	H	5-ciano-3-piridilo
70	H	H	H	H	H	6-ciano-3-piridilo
71	H	H	H	H	H	2-nitro-3-piridilo
72	H	H	H	H	H	4-nitro-3-piridilo
73	H	H	H	H	H	5-nitro-3-piridilo
74	H	H	H	H	H	6-nitro-3-piridilo
75	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-3-piridilo
76	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-3-piridilo
77	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-3-piridilo
78	H	H	H	H	H	6-metanosulfonil-3-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
79	H	H	H	H	H	4-piridilo
80	H	H	H	H	H	2-fluoro-4-piridilo
81	H	H	H	H	H	3-fluoro-4-piridilo
82	H	H	H	H	H	2-cloro-4-piridilo
83	H	H	H	H	H	3-cloro-4-piridilo
84	H	H	H	H	H	2-bromo-4-piridilo
85	H	H	H	H	H	3-bromo-4-piridilo
86	H	H	H	H	H	2-metoxi-4-piridilo
87	H	H	H	H	H	3-metoxi-4-piridilo
88	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-piridilo
89	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-4-piridilo
90	H	H	H	H	H	2-metil-4-piridilo
91	H	H	H	H	H	3-metil-4-piridilo
92	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-4-piridilo
93	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-4-piridilo
94	H	H	H	H	H	2-ciano-4-piridilo
95	H	H	H	H	H	3-ciano-4-piridilo
96	H	H	H	H	H	2-nitro-4-piridilo
97	H	H	H	H	H	3-nitro-4-piridilo
98	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-4-piridilo
99	H	H	H	H	H	3-metanosulfonil-4-piridilo
100	H	H	H	H	H	2-piridazinilo
101	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-piridazinilo
102	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-piridazinilo
103	H	H	H	H	H	6-fluoro-2-piridazinilo
104	H	H	H	H	H	4-cloro-2-piridazinilo
105	H	H	H	H	H	5-cloro-2-piridazinilo
106	H	H	H	H	H	6-cloro-2-piridazinilo
107	H	H	H	H	H	4-bromo-2-piridazinilo
108	H	H	H	H	H	5-bromo-2-piridazinilo
109	H	H	H	H	H	6-bromo-2-piridazinilo
110	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-piridazinilo
111	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-piridazinilo
112	H	H	H	H	H	6-metoxi-2-piridazinilo
113	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-piridazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
114	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-piridazinilo
115	H	H	H	H	H	6-trifluorometoxi-2-piridazinilo
116	H	H	H	H	H	4-metil-2-piridazinilo
117	H	H	H	H	H	5-metil-2-piridazinilo
118	H	H	H	H	H	6-metil-2-piridazinilo
119	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-piridazinilo
120	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-piridazinilo
121	H	H	H	H	H	6-trifluorometil-2-piridazinilo
122	H	H	H	H	H	4-ciano-2-piridazinilo
123	H	H	H	H	H	5-ciano-2-piridazinilo
124	H	H	H	H	H	6-ciano-2-piridazinilo
125	H	H	H	H	H	4-nitro-2-piridazinilo
126	H	H	H	H	H	5-nitro-2-piridazinilo
127	H	H	H	H	H	6-nitro-2-piridazinilo
128	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-piridazinilo
129	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-piridazinilo
130	H	H	H	H	H	6-metanosulfonil-2-piridazinilo
131	H	H	H	H	H	3-piridazinilo
132	H	H	H	H	H	2-fluoro-3-piridazinilo
133	H	H	H	H	H	5-fluoro-3-piridazinilo
134	H	H	H	H	H	6-fluoro-3-piridazinilo
135	H	H	H	H	H	2-cloro-3-piridazinilo
136	H	H	H	H	H	5-cloro-3-piridazinilo
137	H	H	H	H	H	6-cloro-3-piridazinilo
138	H	H	H	H	H	2-bromo-3-piridazinilo
139	H	H	H	H	H	5-bromo-3-piridazinilo
140	H	H	H	H	H	6-bromo-3-piridazinilo
141	H	H	H	H	H	2-metoxi-3-piridazinilo
142	H	H	H	H	H	5-metoxi-3-piridazinilo
143	H	H	H	H	H	6-metoxi-3-piridazinilo
144	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-piridazinilo
145	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-piridazinilo
146	H	H	H	H	H	6-trifluorometoxi-3-piridazinilo
147	H	H	H	H	H	2-metil-3-piridazinilo
148	H	H	H	H	H	5-metil-3-piridazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
149	H	H	H	H	H	6-metil-3-piridazinilo
150	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-3-piridazinilo
151	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-3-piridazinilo
152	H	H	H	H	H	6-trifluorometil-3-piridazinilo
153	H	H	H	H	H	2-ciano-3-piridazinilo
154	H	H	H	H	H	5-ciano-3-piridazinilo
155	H	H	H	H	H	6-ciano-3-piridazinilo
156	H	H	H	H	H	2-nitro-3-piridazinilo
157	H	H	H	H	H	5-nitro-3-piridazinilo
158	H	H	H	H	H	6-nitro-3-piridazinilo
159	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-3-piridazinilo
160	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-3-piridazinilo
161	H	H	H	H	H	6-metanosulfonil-3-piridazinilo
162	H	H	H	H	H	2-pirimidilo
163	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-pirimidilo
164	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-pirimidilo
165	H	H	H	H	H	4-cloro-2-pirimidilo
166	H	H	H	H	H	5-cloro-2-pirimidilo
167	H	H	H	H	H	4-bromo-2-pirimidilo
168	H	H	H	H	H	5-bromo-2-pirimidilo
169	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-pirimidilo
170	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-pirimidilo
171	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-pirimidilo
172	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-pirimidilo
173	H	H	H	H	H	4-metil-2-pirimidilo
174	H	H	H	H	H	5-metil-2-pirimidilo
175	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-pirimidilo
176	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-pirimidilo
177	H	H	H	H	H	4-ciano-2-pirimidilo
178	H	H	H	H	H	5-ciano-2-pirimidilo
179	H	H	H	H	H	4-nitro-2-pirimidilo
180	H	H	H	H	H	5-nitro-2-pirimidilo
181	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-pirimidilo
182	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-pirimidilo
183	H	H	H	H	H	4-pirimidilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
184	H	H	H	H	H	2-fluoro-4-pirimidilo
185	H	H	H	H	H	5-fluoro-4-pirimidilo
186	H	H	H	H	H	6-fluoro-4-pirimidilo
187	H	H	H	H	H	2-cloro-4-pirimidilo
188	H	H	H	H	H	5-cloro-4-pirimidilo
189	H	H	H	H	H	6-cloro-4-pirimidilo
190	H	H	H	H	H	2-bromo-4-pirimidilo
191	H	H	H	H	H	5-bromo-4-pirimidilo
192	H	H	H	H	H	6-bromo-4-pirimidilo
193	H	H	H	H	H	2-metoxi-4-pirimidilo
194	H	H	H	H	H	5-metoxi-4-pirimidilo
195	H	H	H	H	H	6-metoxi-4-pirimidilo
196	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-pirimidilo
197	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-4-pirimidilo
198	H	H	H	H	H	6-trifluorometoxi-4-pirimidilo
199	H	H	H	H	H	2-metil-4-pirimidilo
200	H	H	H	H	H	5-metil-4-pirimidilo
201	H	H	H	H	H	6-metil-4-pirimidilo
202	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-4-pirimidilo
203	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-4-pirimidilo
204	H	H	H	H	H	6-trifluorometil-4-pirimidilo
205	H	H	H	H	H	2-ciano-4-pirimidilo
206	H	H	H	H	H	5-ciano-4-pirimidilo
207	H	H	H	H	H	6-ciano-4-pirimidilo
208	H	H	H	H	H	2-nitro-4-pirimidilo
209	H	H	H	H	H	5-nitro-4-pirimidilo
210	H	H	H	H	H	6-nitro-4-pirimidilo
211	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-4-pirimidilo
212	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-4-pirimidilo
213	H	H	H	H	H	6-metanosulfonil-4-pirimidilo
214	H	H	H	H	H	5-pirimidilo
215	H	H	H	H	H	2-fluoro-5-pirimidilo
216	H	H	H	H	H	4-fluoro-5-pirimidilo
217	H	H	H	H	H	2-cloro-5-pirimidilo
218	H	H	H	H	H	4-cloro-5-pirimidilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
219	H	H	H	H	H	2-bromo-5-pirimidilo
220	H	H	H	H	H	4-bromo-5-pirimidilo
221	H	H	H	H	H	2-metoxi-5-pirimidilo
222	H	H	H	H	H	4-metoxi-5-pirimidilo
223	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-5-pirimidilo
224	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-5-pirimidilo
225	H	H	H	H	H	2-metil-5-pirimidilo
226	H	H	H	H	H	4-metil-5-pirimidilo
227	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-5-pirimidilo
228	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-5-pirimidilo
229	H	H	H	H	H	2-ciano-5-pirimidilo
230	H	H	H	H	H	4-ciano-5-pirimidilo
231	H	H	H	H	H	2-nitro-5-pirimidilo
232	H	H	H	H	H	4-nitro-5-pirimidilo
233	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-5-pirimidilo
234	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-5-pirimidilo
235	H	H	H	H	H	2-pirazinilo
236	H	H	H	H	H	3-fluoro-2-pirazinilo
237	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-pirazinilo
238	H	H	H	H	H	6-fluoro-2-pirazinilo
239	H	H	H	H	H	3-cloro-2-pirazinilo
240	H	H	H	H	H	5-cloro-2-pirazinilo
241	H	H	H	H	H	6-cloro-2-pirazinilo
242	H	H	H	H	H	3-bromo-2-pirazinilo
243	H	H	H	H	H	5-bromo-2-pirazinilo
244	H	H	H	H	H	6-bromo-2-pirazinilo
245	H	H	H	H	H	3-metoxi-2-pirazinilo
246	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-pirazinilo
247	H	H	H	H	H	6-metoxi-2-pirazinilo
248	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-pirazinilo
249	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-pirazinilo
250	H	H	H	H	H	6-trifluorometoxi-2-pirazinilo
251	H	H	H	H	H	3-metil-2-pirazinilo
252	H	H	H	H	H	5-metil-2-pirazinilo
253	H	H	H	H	H	6-metil-2-pirazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
254	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-2-pirazinilo
255	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-pirazinilo
256	H	H	H	H	H	6-trifluorometil-2-pirazinilo
257	H	H	H	H	H	3-ciano-2-pirazinilo
258	H	H	H	H	H	5-ciano-2-pirazinilo
259	H	H	H	H	H	6-ciano-2-pirazinilo
260	H	H	H	H	H	3-nitro-2-pirazinilo
261	H	H	H	H	H	5-nitro-2-pirazinilo
262	H	H	H	H	H	6-nitro-2-pirazinilo
263	H	H	H	H	H	3-metilsulfonato-2-pirazinilo
264	H	H	H	H	H	5-metilsulfonato-2-pirazinilo
265	H	H	H	H	H	6-metilsulfonato-2-pirazinilo
266	H	H	H	H	H	2-furanilo
267	H	H	H	H	H	3-fluoro-2-furanilo
268	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-furanilo
269	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-furanilo
270	H	H	H	H	H	3-cloro-2-furanilo
271	H	H	H	H	H	4-cloro-2-furanilo
272	H	H	H	H	H	5-cloro-2-furanilo
273	H	H	H	H	H	3-bromo-2-furanilo
274	H	H	H	H	H	4-bromo-2-furanilo
275	H	H	H	H	H	5-bromo-2-furanilo
276	H	H	H	H	H	3-metoxi-2-furanilo
277	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-furanilo
278	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-furanilo
279	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-furanilo
280	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-furanilo
281	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-furanilo
282	H	H	H	H	H	3-metil-2-furanilo
283	H	H	H	H	H	4-metil-2-furanilo
284	H	H	H	H	H	5-metil-2-furanilo
285	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-2-furanilo
286	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-furanilo
287	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-furanilo
288	H	H	H	H	H	3-ciano-2-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
289	H	H	H	H	H	4-ciano-2-furanilo
290	H	H	H	H	H	5-ciano-2-furanilo
291	H	H	H	H	H	3-nitro-2-furanilo
292	H	H	H	H	H	4-nitro-2-furanilo
293	H	H	H	H	H	5-nitro-2-furanilo
294	H	H	H	H	H	3-metanosulfonil-2-furanilo
295	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-furanilo
296	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-furanilo
297	H	H	H	H	H	3-furanilo
298	H	H	H	H	H	3-fluoro-2-furanilo
299	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-furanilo
300	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-furanilo
301	H	H	H	H	H	3-cloro-2-furanilo
302	H	H	H	H	H	4-cloro-2-furanilo
303	H	H	H	H	H	5-cloro-2-furanilo
304	H	H	H	H	H	3-bromo-2-furanilo
305	H	H	H	H	H	4-bromo-2-furanilo
306	H	H	H	H	H	5-bromo-2-furanilo
307	H	H	H	H	H	3-metoxi-2-furanilo
308	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-furanilo
309	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-furanilo
310	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-furanilo
311	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-furanilo
312	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-furanilo
313	H	H	H	H	H	3-metil-2-furanilo
314	H	H	H	H	H	4-metil-2-furanilo
315	H	H	H	H	H	5-metil-2-furanilo
316	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-2-furanilo
317	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-furanilo
318	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-furanilo
319	H	H	H	H	H	3-ciano-2-furanilo
320	H	H	H	H	H	4-ciano-2-furanilo
321	H	H	H	H	H	5-ciano-2-furanilo
322	H	H	H	H	H	3-nitro-2-furanilo
323	H	H	H	H	H	4-nitro-2-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
324	H	H	H	H	H	5-nitro-2-furanilo
325	H	H	H	H	H	3-metanosulfonil-2-furanilo
326	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-furanilo
327	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-furanilo
328	H	H	H	H	H	3-furanilo
329	H	H	H	H	H	2-fluoro-3-furanilo
330	H	H	H	H	H	4-fluoro-3-furanilo
331	H	H	H	H	H	5-fluoro-3-furanilo
332	H	H	H	H	H	2-cloro-3-furanilo
333	H	H	H	H	H	4-cloro-3-furanilo
334	H	H	H	H	H	5-cloro-3-furanilo
335	H	H	H	H	H	2-bromo-3-furanilo
336	H	H	H	H	H	4-bromo-3-furanilo
337	H	H	H	H	H	5-bromo-3-furanilo
338	H	H	H	H	H	2-metoxi-3-furanilo
339	H	H	H	H	H	4-metoxi-3-furanilo
340	H	H	H	H	H	5-metoxi-3-furanilo
341	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-furanilo
342	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-3-furanilo
343	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-furanilo
344	H	H	H	H	H	2-metil-3-furanilo
345	H	H	H	H	H	4-metil-3-furanilo
346	H	H	H	H	H	5-metil-3-furanilo
347	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-3-furanilo
348	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-3-furanilo
349	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-3-furanilo
350	H	H	H	H	H	2-ciano-3-furanilo
351	H	H	H	H	H	4-ciano-3-furanilo
352	H	H	H	H	H	5-ciano-3-furanilo
353	H	H	H	H	H	2-nitro-3-furanilo
354	H	H	H	H	H	4-nitro-3-furanilo
355	H	H	H	H	H	5-nitro-3-furanilo
356	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-3-furanilo
357	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-3-furanilo
358	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-3-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
359	H	H	H	H	H	2-tiofenilo
360	H	H	H	H	H	3-fluoro-2-tiofenilo
361	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-tiofenilo
362	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-tiofenilo
363	H	H	H	H	H	3-cloro-2-tiofenilo
364	H	H	H	H	H	4-cloro-2-tiofenilo
365	H	H	H	H	H	5-cloro-2-tiofenilo
366	H	H	H	H	H	3-bromo-2-tiofenilo
367	H	H	H	H	H	4-bromo-2-tiofenilo
368	H	H	H	H	H	5-bromo-2-tiofenilo
369	H	H	H	H	H	3-metoxi-2-tiofenilo
370	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-tiofenilo
371	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-tiofenilo
372	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-tiofenilo
373	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiofenilo
374	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiofenilo
375	H	H	H	H	H	3-metil-2-tiofenilo
376	H	H	H	H	H	4-metil-2-tiofenilo
377	H	H	H	H	H	5-metil-2-tiofenilo
378	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-2-tiofenilo
379	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-tiofenilo
380	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-tiofenilo
381	H	H	H	H	H	3-ciano-2-tiofenilo
382	H	H	H	H	H	4-ciano-2-tiofenilo
383	H	H	H	H	H	5-ciano-2-tiofenilo
384	H	H	H	H	H	3-nitro-2-tiofenilo
385	H	H	H	H	H	4-nitro-2-tiofenilo
386	H	H	H	H	H	5-nitro-2-tiofenilo
387	H	H	H	H	H	3-metanosulfonil-2-tiofenilo
388	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-tiofenilo
389	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-tiofenilo
390	H	H	H	H	H	3-tiofenilo
391	H	H	H	H	H	3-fluoro-2-tiofenilo
392	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-tiofenilo
393	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
394	H	H	H	H	H	3-cloro-2-tiofenilo
395	H	H	H	H	H	4-cloro-2-tiofenilo
396	H	H	H	H	H	5-cloro-2-tiofenilo
397	H	H	H	H	H	3-bromo-2-tiofenilo
398	H	H	H	H	H	4-bromo-2-tiofenilo
399	H	H	H	H	H	5-bromo-2-tiofenilo
400	H	H	H	H	H	3-metoxi-2-tiofenilo
401	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-tiofenilo
402	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-tiofenilo
403	H	H	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-tiofenilo
404	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiofenilo
405	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiofenilo
406	H	H	H	H	H	3-metil-2-tiofenilo
407	H	H	H	H	H	4-metil-2-tiofenilo
408	H	H	H	H	H	5-metil-2-tiofenilo
409	H	H	H	H	H	3-trifluorometil-2-tiofenilo
410	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-tiofenilo
411	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-tiofenilo
412	H	H	H	H	H	3-ciano-2-tiofenilo
413	H	H	H	H	H	4-ciano-2-tiofenilo
414	H	H	H	H	H	5-ciano-2-tiofenilo
415	H	H	H	H	H	3-nitro-2-tiofenilo
416	H	H	H	H	H	4-nitro-2-tiofenilo
417	H	H	H	H	H	5-nitro-2-tiofenilo
418	H	H	H	H	H	3-metanosulfonil-2-tiofenilo
419	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-tiofenilo
420	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-tiofenilo
421	H	H	H	H	H	3-tiofenilo
422	H	H	H	H	H	2-fluoro-3-tiofenilo
423	H	H	H	H	H	4-fluoro-3-tiofenilo
424	H	H	H	H	H	5-fluoro-3-tiofenilo
425	H	H	H	H	H	2-cloro-3-tiofenilo
426	H	H	H	H	H	4-cloro-3-tiofenilo
427	H	H	H	H	H	5-cloro-3-tiofenilo
428	H	H	H	H	H	2-bromo-3-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
429	H	H	H	H	H	4-bromo-3-tiofenilo
430	H	H	H	H	H	5-bromo-3-tiofenilo
431	H	H	H	H	H	2-metoxi-3-tiofenilo
432	H	H	H	H	H	4-metoxi-3-tiofenilo
433	H	H	H	H	H	5-metoxi-3-tiofenilo
434	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-tiofenilo
435	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-3-tiofenilo
436	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-tiofenilo
437	H	H	H	H	H	2-metil-3-tiofenilo
438	H	H	H	H	H	4-metil-3-tiofenilo
439	H	H	H	H	H	5-metil-3-tiofenilo
440	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-3-tiofenilo
441	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-3-tiofenilo
442	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-3-tiofenilo
443	H	H	H	H	H	2-ciano-3-tiofenilo
444	H	H	H	H	H	4-ciano-3-tiofenilo
445	H	H	H	H	H	5-ciano-3-tiofenilo
446	H	H	H	H	H	2-nitro-3-tiofenilo
447	H	H	H	H	H	4-nitro-3-tiofenilo
448	H	H	H	H	H	5-nitro-3-tiofenilo
449	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-3-tiofenilo
450	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-3-tiofenilo
451	H	H	H	H	H	5-metanosufonil-3-tiofenilo
452	H	H	H	H	H	2-ozaxol
453	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-ozaxol
454	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-ozaxol
455	H	H	H	H	H	4-cloro-2-ozaxol
456	H	H	H	H	H	5-cloro-2-ozaxol
457	H	H	H	H	H	4-bromo-2-ozaxol
458	H	H	H	H	H	5-bromo-2-ozaxol
459	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-ozaxol
460	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-ozaxol
461	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-ozaxol
462	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-ozaxol
463	H	H	H	H	H	4-metil-2-ozaxol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
464	H	H	H	H	H	5-metil-2-ozaxol
465	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-ozaxol
466	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-ozaxol
467	H	H	H	H	H	4-ciano-2-ozaxol
468	H	H	H	H	H	5-ciano-2-ozaxol
469	H	H	H	H	H	4-nitro-2-ozaxol
470	H	H	H	H	H	5-nitro-2-ozaxol
471	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-ozaxol
472	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-ozaxol
473	H	H	H	H	H	4-ozaxol
474	H	H	H	H	H	2-fluoro-4-ozaxol
475	H	H	H	H	H	5-fluoro-4-ozaxol
476	H	H	H	H	H	2-cloro-4-ozaxol
477	H	H	H	H	H	5-cloro-4-ozaxol
478	H	H	H	H	H	2-bromo-4-ozaxol
479	H	H	H	H	H	5-bromo-4-ozaxol
480	H	H	H	H	H	2-metoxi-4-ozaxol
481	H	H	H	H	H	5-metoxi-4-ozaxol
482	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-ozaxol
483	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-4-ozaxol
484	H	H	H	H	H	2-metil-4-ozaxol
485	H	H	H	H	H	5-metil-4-ozaxol
486	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-4-ozaxol
487	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-4-ozaxol
488	H	H	H	H	H	4-ciano-4-ozaxol
489	H	H	H	H	H	5-ciano-4-ozaxol
490	H	H	H	H	H	4-nitro-4-ozaxol
491	H	H	H	H	H	5-nitro-4-ozaxol
492	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-4-ozaxol
493	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-4-ozaxol
494	H	H	H	H	H	5-ozaxol
495	H	H	H	H	H	2-fluoro-5-ozaxol
496	H	H	H	H	H	4-fluoro-5-ozaxol
497	H	H	H	H	H	2-cloro-5-ozaxol
498	H	H	H	H	H	4-cloro-5-ozaxol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
499	H	H	H	H	H	2-bromo-5-oxazol
500	H	H	H	H	H	4-bromo-5-oxazol
501	H	H	H	H	H	2-metoxi-5-oxazol
502	H	H	H	H	H	4-metoxi-5-oxazol
503	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-5-oxazol
504	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-5-oxazol
505	H	H	H	H	H	2-metil-5-oxazol
506	H	H	H	H	H	4-metil-5-oxazol
507	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-5-oxazol
508	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-5-oxazol
509	H	H	H	H	H	2-ciano-5-oxazol
510	H	H	H	H	H	4-ciano-5-oxazol
511	H	H	H	H	H	2-nitro-5-oxazol
512	H	H	H	H	H	4-nitro-5-oxazol
513	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-5-oxazol
514	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-5-oxazol
515	H	H	H	H	H	2-tiazol
516	H	H	H	H	H	4-fluoro-2-tiazol
517	H	H	H	H	H	5-fluoro-2-tiazol
518	H	H	H	H	H	4-cloro-2-tiazol
519	H	H	H	H	H	5-cloro-2-tiazol
520	H	H	H	H	H	4-bromo-2-tiazol
521	H	H	H	H	H	5-bromo-2-tiazol
522	H	H	H	H	H	4-metoxi-2-tiazol
523	H	H	H	H	H	5-metoxi-2-tiazol
524	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiazol
525	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiazol
526	H	H	H	H	H	4-metil-2-tiazol
527	H	H	H	H	H	5-metil-2-tiazol
528	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-2-tiazol
529	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-2-tiazol
530	H	H	H	H	H	4-ciano-2-tiazol
531	H	H	H	H	H	5-ciano-2-tiazol
532	H	H	H	H	H	4-nitro-2-tiazol
533	H	H	H	H	H	5-nitro-2-tiazol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
534	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-2-tiazol
535	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-2-tiazol
536	H	H	H	H	H	4-tiazol
537	H	H	H	H	H	2-fluoro-4-tiazol
538	H	H	H	H	H	5-fluoro-4-tiazol
539	H	H	H	H	H	2-cloro-4-tiazol
540	H	H	H	H	H	5-cloro-4-tiazol
541	H	H	H	H	H	2-bromo-4-tiazol
542	H	H	H	H	H	5-bromo-4-tiazol
543	H	H	H	H	H	2-metoxi-4-tiazol
544	H	H	H	H	H	5-metoxi-4-tiazol
545	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-tiazol
546	H	H	H	H	H	5-trifluorometoxi-4-tiazol
547	H	H	H	H	H	2-metil-4-tiazol
548	H	H	H	H	H	5-metil-4-tiazol
549	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-4-tiazol
550	H	H	H	H	H	5-trifluorometil-4-tiazol
551	H	H	H	H	H	4-ciano-4-tiazol
552	H	H	H	H	H	5-ciano-4-tiazol
553	H	H	H	H	H	4-nitro-4-tiazol
554	H	H	H	H	H	5-nitro-4-tiazol
555	H	H	H	H	H	4-metanosulfonil-4-tiazol
556	H	H	H	H	H	5-metanosulfonil-4-tiazol
557	H	H	H	H	H	5-tiazol
558	H	H	H	H	H	2-fluoro-5-tiazol
559	H	H	H	H	H	4-fluoro-5-tiazol
560	H	H	H	H	H	2-cloro-5-tiazol
561	H	H	H	H	H	4-cloro-5-tiazol
562	H	H	H	H	H	2-bromo-5-tiazol
563	H	H	H	H	H	4-bromo-5-tiazol
564	H	H	H	H	H	2-metoxi-5-tiazol
565	H	H	H	H	H	4-metoxi-5-tiazol
566	H	H	H	H	H	2-trifluorometoxi-5-tiazol
567	H	H	H	H	H	4-trifluorometoxi-5-tiazol
568	H	H	H	H	H	2-metil-5-tiazol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
569	H	H	H	H	H	4-metil-5-tiazol
570	H	H	H	H	H	2-trifluorometil-5-tiazol
571	H	H	H	H	H	4-trifluorometil-5-tiazol
572	H	H	H	H	H	2-ciano-5-tiazol
573	H	H	H	H	H	4-ciano-5-tiazol
574	H	H	H	H	H	2-nitro-5-tiazol
575	H	H	H	H	H	4-nitro-5-tiazol
576	H	H	H	H	H	2-metanosulfonil-5-tiazol
577	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-5-tiazol
578	H	CH ₃	H	H	H	2-piridilo
579	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-piridilo
580	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-piridilo
581	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-piridilo
582	H	CH ₃	H	H	H	6-fluoro-2-piridilo
583	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-piridilo
584	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-piridilo
585	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-piridilo
586	H	CH ₃	H	H	H	6-cloro-2-piridilo
587	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-2-piridilo
588	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-piridilo
589	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-piridilo
590	H	CH ₃	H	H	H	6-metil-2-piridilo
591	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-2-piridilo
592	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-piridilo
593	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-piridilo
594	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometil-2-piridilo
595	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-2-piridilo
596	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-piridilo
597	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-piridilo
598	H	CH ₃	H	H	H	6-metoxi-2-piridilo
599	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-piridilo
600	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-piridilo
601	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-piridilo
602	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometoxi-2-piridilo
603	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
604	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-piridilo
605	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-piridilo
606	H	CH ₃	H	H	H	6-ciano-2-piridilo
607	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-2-piridilo
608	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-piridilo
609	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-piridilo
610	H	CH ₃	H	H	H	6-nitro-2-piridilo
611	H	CH ₃	H	H	H	3-metanosulfonil-2-piridilo
612	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-piridilo
613	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-piridilo
614	H	CH ₃	H	H	H	6-metanosulfonil-2-piridilo
615	H	CH ₃	H	H	H	3-piridilo
616	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-3-piridilo
617	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-3-piridilo
618	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-3-piridilo
619	H	CH ₃	H	H	H	6-fluoro-3-piridilo
620	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-piridilo
621	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-piridilo
622	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-3-piridilo
623	H	CH ₃	H	H	H	6-cloro-3-piridilo
624	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-3-piridilo
625	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-3-piridilo
626	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-3-piridilo
627	H	CH ₃	H	H	H	6-bromo-3-piridilo
628	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-3-piridilo
629	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-3-piridilo
630	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-3-piridilo
631	H	CH ₃	H	H	H	6-metoxi-3-piridilo
632	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-piridilo
633	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-3-piridilo
634	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-piridilo
635	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometoxi-3-piridilo
636	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-3-piridilo
637	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-3-piridilo
638	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-3-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
639	H	CH ₃	H	H	H	6-metil-3-piridilo
640	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-3-piridilo
641	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-3-piridilo
642	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-3-piridilo
643	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometil-3-piridilo
644	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-3-piridilo
645	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-3-piridilo
646	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-3-piridilo
647	H	CH ₃	H	H	H	6-ciano-3-piridilo
648	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-3-piridilo
649	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-3-piridilo
650	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-3-piridilo
651	H	CH ₃	H	H	H	6-nitro-3-piridilo
652	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-3-piridilo
653	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-3-piridilo
654	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-3-piridilo
655	H	CH ₃	H	H	H	6-metanosulfonil-3-piridilo
656	H	CH ₃	H	H	H	4-piridilo
657	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-4-piridilo
658	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-4-piridilo
659	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-piridilo
660	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-4-piridilo
661	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-4-piridilo
662	H	CH ₃	H	H	H	3-bromo-4-piridilo
663	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-4-piridilo
664	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-4-piridilo
665	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-piridilo
666	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-4-piridilo
667	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-4-piridilo
668	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-4-piridilo
669	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-4-piridilo
670	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-4-piridilo
671	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-4-piridilo
672	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-4-piridilo
673	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-4-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
674	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-4-piridilo
675	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-4-piridilo
676	H	CH ₃	H	H	H	3-metanosulfonil-4-piridilo
677	H	CH ₃	H	H	H	2-piridazinilo
678	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-piridazinilo
679	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-piridazinilo
680	H	CH ₃	H	H	H	6-fluoro-2-piridazinilo
681	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-piridazinilo
682	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-piridazinilo
683	H	CH ₃	H	H	H	6-cloro-2-piridazinilo
684	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-piridazinilo
685	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-piridazinilo
686	H	CH ₃	H	H	H	6-bromo-2-piridazinilo
687	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-piridazinilo
688	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-piridazinilo
689	H	CH ₃	H	H	H	6-metoxi-2-piridazinilo
690	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-piridazinilo
691	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-piridazinilo
692	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometoxi-2-piridazinilo
693	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-piridazinilo
694	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-piridazinilo
695	H	CH ₃	H	H	H	6-metil-2-piridazinilo
696	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-piridazinilo
697	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-piridazinilo
698	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometil-2-piridazinilo
699	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-piridazinilo
700	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-piridazinilo
701	H	CH ₃	H	H	H	6-ciano-2-piridazinilo
702	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-piridazinilo
703	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-piridazinilo
704	H	CH ₃	H	H	H	6-nitro-2-piridazinilo
705	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-piridazinilo
706	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-piridazinilo
707	H	CH ₃	H	H	H	6-metanosulfonil-2-piridazinilo
708	H	CH ₃	H	H	H	3-piridazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
709	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-3-piridazinilo
710	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-3-piridazinilo
711	H	CH ₃	H	H	H	6-fluoro-3-piridazinilo
712	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-piridazinilo
713	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-3-piridazinilo
714	H	CH ₃	H	H	H	6-cloro-3-piridazinilo
715	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-3-piridazinilo
716	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-3-piridazinilo
717	H	CH ₃	H	H	H	6-bromo-3-piridazinilo
718	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-3-piridazinilo
719	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-3-piridazinilo
720	H	CH ₃	H	H	H	6-metoxi-3-piridazinilo
721	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-piridazinilo
722	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-piridazinilo
723	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometoxi-3-piridazinilo
724	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-3-piridazinilo
725	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-3-piridazinilo
726	H	CH ₃	H	H	H	6-metil-3-piridazinilo
727	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-3-piridazinilo
728	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-3-piridazinilo
729	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometil-3-piridazinilo
730	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-3-piridazinilo
731	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-3-piridazinilo
732	H	CH ₃	H	H	H	6-ciano-3-piridazinilo
733	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-3-piridazinilo
734	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-3-piridazinilo
735	H	CH ₃	H	H	H	6-nitro-3-piridazinilo
736	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-3-piridazinilo
737	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-3-piridazinilo
738	H	CH ₃	H	H	H	6-metanosulfonil-3-piridazinilo
739	H	CH ₃	H	H	H	2-pirimidilo
740	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-pirimidilo
741	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-pirimidilo
742	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-pirimidilo
743	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-pirimidilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
744	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-pirimidilo
745	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-pirimidilo
746	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-pirimidilo
747	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-pirimidilo
748	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-pirimidilo
749	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-pirimidilo
750	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-pirimidilo
751	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-pirimidilo
752	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-pirimidilo
753	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-pirimidilo
754	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-pirimidilo
755	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-pirimidilo
756	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-pirimidilo
757	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-pirimidilo
758	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-pirimidilo
759	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-pirimidilo
760	H	CH ₃	H	H	H	4-pirimidilo
761	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-4-pirimidilo
762	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-4-pirimidilo
763	H	CH ₃	H	H	H	6-fluoro-4-pirimidilo
764	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-pirimidilo
765	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-4-pirimidilo
766	H	CH ₃	H	H	H	6-cloro-4-pirimidilo
767	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-4-pirimidilo
768	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-4-pirimidilo
769	H	CH ₃	H	H	H	6-bromo-4-pirimidilo
770	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-4-pirimidilo
771	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-4-pirimidilo
772	H	CH ₃	H	H	H	6-metoxi-4-pirimidilo
773	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-pirimidilo
774	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-4-pirimidilo
775	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometoxi-4-pirimidilo
776	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-4-pirimidilo
777	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-4-pirimidilo
778	H	CH ₃	H	H	H	6-metil-4-pirimidilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
779	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-4-pirimidilo
780	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-4-pirimidilo
781	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometil-4-pirimidilo
782	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-4-pirimidilo
783	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-4-pirimidilo
784	H	CH ₃	H	H	H	6-ciano-4-pirimidilo
785	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-4-pirimidilo
786	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-4-pirimidilo
787	H	CH ₃	H	H	H	6-nitro-4-pirimidilo
788	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-4-pirimidilo
789	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-4-pirimidilo
790	H	CH ₃	H	H	H	6-metanosulfonil-4-pirimidilo
791	H	CH ₃	H	H	H	5-pirimidilo
792	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-5-pirimidilo
793	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-5-pirimidilo
794	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-pirimidilo
795	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-5-pirimidilo
796	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-5-pirimidilo
797	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-5-pirimidilo
798	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-5-pirimidilo
799	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-5-pirimidilo
800	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-5-pirimidilo
801	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-5-pirimidilo
802	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-5-pirimidilo
803	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-5-pirimidilo
804	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-5-pirimidilo
805	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-5-pirimidilo
806	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-5-pirimidilo
807	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-5-pirimidilo
808	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-5-pirimidilo
809	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-5-pirimidilo
810	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-5-pirimidilo
811	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-5-pirimidilo
812	H	CH ₃	H	H	H	2-pirazinilo
813	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-pirazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
814	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-pirazinilo
815	H	CH ₃	H	H	H	6-fluoro-2-pirazinilo
816	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-pirazinilo
817	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-pirazinilo
818	H	CH ₃	H	H	H	6-cloro-2-pirazinilo
819	H	CH ₃	H	H	H	3-bromo-2-pirazinilo
820	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-pirazinilo
821	H	CH ₃	H	H	H	6-bromo-2-pirazinilo
822	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-2-pirazinilo
823	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-pirazinilo
824	H	CH ₃	H	H	H	6-metoxi-2-pirazinilo
825	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-pirazinilo
826	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-pirazinilo
827	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometoxi-2-pirazinilo
828	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-2-pirazinilo
829	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-pirazinilo
830	H	CH ₃	H	H	H	6-metil-2-pirazinilo
831	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-2-pirazinilo
832	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-pirazinilo
833	H	CH ₃	H	H	H	6-trifluorometil-2-pirazinilo
834	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-pirazinilo
835	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-pirazinilo
836	H	CH ₃	H	H	H	6-ciano-2-pirazinilo
837	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-2-pirazinilo
838	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-pirazinilo
839	H	CH ₃	H	H	H	6-nitro-2-pirazinilo
840	H	CH ₃	H	H	H	3-metilsulfonato-2-pirazinilo
841	H	CH ₃	H	H	H	5-metilsulfonato-2-pirazinilo
842	H	CH ₃	H	H	H	6-metilsulfonato-2-pirazinilo
843	H	CH ₃	H	H	H	2-furanilo
844	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-furanilo
845	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-furanilo
846	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-furanilo
847	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-furanilo
848	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
849	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-furanilo
850	H	CH ₃	H	H	H	3-bromo-2-furanilo
851	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-furanilo
852	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-furanilo
853	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-2-furanilo
854	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-furanilo
855	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-furanilo
856	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-furanilo
857	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-furanilo
858	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-furanilo
859	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-2-furanilo
860	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-furanilo
861	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-furanilo
862	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-2-furanilo
863	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-furanilo
864	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-furanilo
865	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-furanilo
866	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-furanilo
867	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-furanilo
868	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-2-furanilo
869	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-furanilo
870	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-furanilo
871	H	CH ₃	H	H	H	3-metanosulfonil-2-furanilo
872	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-furanilo
873	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-furanilo
874	H	CH ₃	H	H	H	3-furanilo
875	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-furanilo
876	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-furanilo
877	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-furanilo
878	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-furanilo
879	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-furanilo
880	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-furanilo
881	H	CH ₃	H	H	H	3-bromo-2-furanilo
882	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-furanilo
883	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
884	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-2-furanilo
885	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-furanilo
886	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-furanilo
887	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-furanilo
888	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-furanilo
889	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-furanilo
890	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-2-furanilo
891	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-furanilo
892	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-furanilo
893	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-2-furanilo
894	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-furanilo
895	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-furanilo
896	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-furanilo
897	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-furanilo
898	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-furanilo
899	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-2-furanilo
900	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-furanilo
901	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-furanilo
902	H	CH ₃	H	H	H	3-metanosulfonil-2-furanilo
903	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-furanilo
904	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-furanilo
905	H	CH ₃	H	H	H	3-furanilo
906	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-3-furanilo
907	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-3-furanilo
908	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-3-furanilo
909	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-furanilo
910	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-furanilo
911	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-3-furanilo
912	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-3-furanilo
913	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-3-furanilo
914	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-3-furanilo
915	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-3-furanilo
916	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-3-furanilo
917	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-3-furanilo
918	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
919	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-3-furanilo
920	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-furanilo
921	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-3-furanilo
922	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-3-furanilo
923	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-3-furanilo
924	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-3-furanilo
925	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-3-furanilo
926	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-3-furanilo
927	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-3-furanilo
928	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-3-furanilo
929	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-3-furanilo
930	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-3-furanilo
931	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-3-furanilo
932	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-3-furanilo
933	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-3-furanilo
934	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-3-furanilo
935	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-3-furanilo
936	H	CH ₃	H	H	H	2-tiofenilo
937	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-tiofenilo
938	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-tiofenilo
939	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-tiofenilo
940	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-tiofenilo
941	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-tiofenilo
942	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-tiofenilo
943	H	CH ₃	H	H	H	3-bromo-2-tiofenilo
944	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-tiofenilo
945	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-tiofenilo
946	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-2-tiofenilo
947	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-tiofenilo
948	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-tiofenilo
949	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-tiofenilo
950	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiofenilo
951	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiofenilo
952	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-2-tiofenilo
953	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
954	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-tiofenilo
955	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-2-tiofenilo
956	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-tiofenilo
957	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-tiofenilo
958	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-tiofenilo
959	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-tiofenilo
960	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-tiofenilo
961	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-2-tiofenilo
962	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-tiofenilo
963	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-tiofenilo
964	H	CH ₃	H	H	H	3-metanosulfonil-2-tiofenilo
965	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-tiofenilo
966	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-tiofenilo
967	H	CH ₃	H	H	H	3-tiofenilo
968	H	CH ₃	H	H	H	3-fluoro-2-tiofenilo
969	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-tiofenilo
970	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-tiofenilo
971	H	CH ₃	H	H	H	3-cloro-2-tiofenilo
972	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-tiofenilo
973	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-tiofenilo
974	H	CH ₃	H	H	H	3-bromo-2-tiofenilo
975	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-tiofenilo
976	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-tiofenilo
977	H	CH ₃	H	H	H	3-metoxi-2-tiofenilo
978	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-tiofenilo
979	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-tiofenilo
980	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometoxi-2-tiofenilo
981	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiofenilo
982	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiofenilo
983	H	CH ₃	H	H	H	3-metil-2-tiofenilo
984	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-tiofenilo
985	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-tiofenilo
986	H	CH ₃	H	H	H	3-trifluorometil-2-tiofenilo
987	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-tiofenilo
988	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
989	H	CH ₃	H	H	H	3-ciano-2-tiofenilo
990	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-tiofenilo
991	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-tiofenilo
992	H	CH ₃	H	H	H	3-nitro-2-tiofenilo
993	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-tiofenilo
994	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-tiofenilo
995	H	CH ₃	H	H	H	3-metanosulfonil-2-tiofenilo
996	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-tiofenilo
997	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-tiofenilo
998	H	CH ₃	H	H	H	3-tiofenilo
999	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-3-tiofenilo
1000	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-3-tiofenilo
1001	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-3-tiofenilo
1002	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-3-tiofenilo
1003	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-3-tiofenilo
1004	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-3-tiofenilo
1005	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-3-tiofenilo
1006	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-3-tiofenilo
1007	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-3-tiofenilo
1008	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-3-tiofenilo
1009	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-3-tiofenilo
1010	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-3-tiofenilo
1011	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-3-tiofenilo
1012	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-3-tiofenilo
1013	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-3-tiofenilo
1014	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-3-tiofenilo
1015	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-3-tiofenilo
1016	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-3-tiofenilo
1017	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-3-tiofenilo
1018	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-3-tiofenilo
1019	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-3-tiofenilo
1020	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-3-tiofenilo
1021	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-3-tiofenilo
1022	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-3-tiofenilo
1023	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-3-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1024	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-3-tiofenilo
1025	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-3-tiofenilo
1026	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-3-tiofenilo
1027	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-3-tiofenilo
1028	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-3-tiofenilo
1029	H	CH ₃	H	H	H	2-oxazol
1030	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-oxazol
1031	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-oxazol
1032	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-oxazol
1033	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-oxazol
1034	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-oxazol
1035	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-oxazol
1036	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-oxazol
1037	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-oxazol
1038	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-oxazol
1039	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-oxazol
1040	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-oxazol
1041	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-oxazol
1042	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-oxazol
1043	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-oxazol
1044	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-oxazol
1045	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-oxazol
1046	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-oxazol
1047	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-oxazol
1048	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-oxazol
1049	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-oxazol
1050	H	CH ₃	H	H	H	4-oxazol
1051	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-4-oxazol
1052	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-4-oxazol
1053	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-oxazol
1054	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-4-oxazol
1055	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-4-oxazol
1056	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-4-oxazol
1057	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-4-oxazol
1058	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-4-oxazol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1059	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-ozaxol
1060	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-4-ozaxol
1061	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-4-ozaxol
1062	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-4-ozaxol
1063	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-4-ozaxol
1064	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-4-ozaxol
1065	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-4-ozaxol
1066	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-4-ozaxol
1067	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-4-ozaxol
1068	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-4-ozaxol
1069	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-4-ozaxol
1070	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-4-ozaxol
1071	H	CH ₃	H	H	H	5-ozaxol
1072	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-5-ozaxol
1073	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-5-ozaxol
1074	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-ozaxol
1075	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-5-ozaxol
1076	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-5-ozaxol
1077	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-5-ozaxol
1078	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-5-ozaxol
1079	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-5-ozaxol
1080	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-5-ozaxol
1081	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-5-ozaxol
1082	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-5-ozaxol
1083	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-5-ozaxol
1084	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-5-ozaxol
1085	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-5-ozaxol
1086	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-5-ozaxol
1087	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-5-ozaxol
1088	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-5-ozaxol
1089	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-5-ozaxol
1090	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-5-ozaxol
1091	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-5-ozaxol
1092	H	CH ₃	H	H	H	2-tiazol
1093	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-2-tiazol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1094	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-2-tiazol
1095	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-2-tiazol
1096	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-2-tiazol
1097	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-2-tiazol
1098	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-2-tiazol
1099	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-2-tiazol
1100	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-2-tiazol
1101	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiazol
1102	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiazol
1103	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-2-tiazol
1104	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-2-tiazol
1105	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-2-tiazol
1106	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-2-tiazol
1107	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-2-tiazol
1108	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-2-tiazol
1109	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-2-tiazol
1110	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-2-tiazol
1111	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-2-tiazol
1112	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-2-tiazol
1113	H	CH ₃	H	H	H	4-tiazol
1114	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-4-tiazol
1115	H	CH ₃	H	H	H	5-fluoro-4-tiazol
1116	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-4-tiazol
1117	H	CH ₃	H	H	H	5-cloro-4-tiazol
1118	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-4-tiazol
1119	H	CH ₃	H	H	H	5-bromo-4-tiazol
1120	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-4-tiazol
1121	H	CH ₃	H	H	H	5-metoxi-4-tiazol
1122	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-4-tiazol
1123	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometoxi-4-tiazol
1124	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-4-tiazol
1125	H	CH ₃	H	H	H	5-metil-4-tiazol
1126	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-4-tiazol
1127	H	CH ₃	H	H	H	5-trifluorometil-4-tiazol
1128	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-4-tiazol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1129	H	CH ₃	H	H	H	5-ciano-4-tiazol
1130	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-4-tiazol
1131	H	CH ₃	H	H	H	5-nitro-4-tiazol
1132	H	CH ₃	H	H	H	4-metanosulfonil-4-tiazol
1133	H	CH ₃	H	H	H	5-metanosulfonil-4-tiazol
1134	H	CH ₃	H	H	H	5-tiazol
1135	H	CH ₃	H	H	H	2-fluoro-5-tiazol
1136	H	CH ₃	H	H	H	4-fluoro-5-tiazol
1137	H	CH ₃	H	H	H	2-cloro-5-tiazol
1138	H	CH ₃	H	H	H	4-cloro-5-tiazol
1139	H	CH ₃	H	H	H	2-bromo-5-tiazol
1140	H	CH ₃	H	H	H	4-bromo-5-tiazol
1141	H	CH ₃	H	H	H	2-metoxi-5-tiazol
1142	H	CH ₃	H	H	H	4-metoxi-5-tiazol
1143	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometoxi-5-tiazol
1144	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometoxi-5-tiazol
1145	H	CH ₃	H	H	H	2-metil-5-tiazol
1146	H	CH ₃	H	H	H	4-metil-5-tiazol
1147	H	CH ₃	H	H	H	2-trifluorometil-5-tiazol
1148	H	CH ₃	H	H	H	4-trifluorometil-5-tiazol
1149	H	CH ₃	H	H	H	2-ciano-5-tiazol
1150	H	CH ₃	H	H	H	4-ciano-5-tiazol
1151	H	CH ₃	H	H	H	2-nitro-5-tiazol
1152	H	CH ₃	H	H	H	4-nitro-5-tiazol
1153	H	CH ₃	H	H	H	2-metanosulfonil-5-tiazol
1154	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-5-tiazol
1155	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-piridilo
1156	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-2-piridilo
1157	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-piridilo
1158	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-piridilo
1159	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-fluoro-2-piridilo
1160	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-2-piridilo
1161	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-piridilo
1162	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-piridilo
1163	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-cloro-2-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1164	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-2-piridilo
1165	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-piridilo
1166	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-piridilo
1167	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metil-2-piridilo
1168	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-2-piridilo
1169	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-piridilo
1170	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-piridilo
1171	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometil-2-piridilo
1172	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-2-piridilo
1173	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-piridilo
1174	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-piridilo
1175	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metoxi-2-piridilo
1176	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-2-piridilo
1177	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-piridilo
1178	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-piridilo
1179	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometoxi-2-piridilo
1180	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-2-piridilo
1181	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-piridilo
1182	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-piridilo
1183	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-ciano-2-piridilo
1184	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-2-piridilo
1185	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-piridilo
1186	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-piridilo
1187	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-nitro-2-piridilo
1188	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metanosulfonil-2-piridilo
1189	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-piridilo
1190	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-piridilo
1191	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metanosulfonil-2-piridilo
1192	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-piridilo
1193	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-3-piridilo
1194	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-3-piridilo
1195	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-3-piridilo
1196	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-fluoro-3-piridilo
1197	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-3-piridilo
1198	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-3-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1199	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-3-piridilo
1200	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-cloro-3-piridilo
1201	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-3-piridilo
1202	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-3-piridilo
1203	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-3-piridilo
1204	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-bromo-3-piridilo
1205	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-3-piridilo
1206	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-3-piridilo
1207	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-3-piridilo
1208	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metoxi-3-piridilo
1209	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-3-piridilo
1210	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-3-piridilo
1211	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-3-piridilo
1212	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometoxi-3-piridilo
1213	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-3-piridilo
1214	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-3-piridilo
1215	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-3-piridilo
1216	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metil-3-piridilo
1217	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-3-piridilo
1218	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-3-piridilo
1219	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-3-piridilo
1220	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometil-3-piridilo
1221	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-3-piridilo
1222	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-3-piridilo
1223	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-3-piridilo
1224	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-ciano-3-piridilo
1225	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-3-piridilo
1226	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-3-piridilo
1227	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-3-piridilo
1228	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-nitro-3-piridilo
1229	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-3-piridilo
1230	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-3-piridilo
1231	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-3-piridilo
1232	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metanosulfonil-3-piridilo
1233	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-piridilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1234	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-4-piridilo
1235	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-4-piridilo
1236	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-4-piridilo
1237	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-4-piridilo
1238	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-4-piridilo
1239	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-bromo-4-piridilo
1240	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-4-piridilo
1241	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-4-piridilo
1242	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-4-piridilo
1243	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-4-piridilo
1244	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-4-piridilo
1245	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-4-piridilo
1246	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-4-piridilo
1247	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-4-piridilo
1248	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-4-piridilo
1249	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-4-piridilo
1250	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-4-piridilo
1251	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-4-piridilo
1252	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-4-piridilo
1253	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metanosulfonil-4-piridilo
1254	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-piridazinilo
1255	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-piridazinilo
1256	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-piridazinilo
1257	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-fluoro-2-piridazinilo
1258	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-piridazinilo
1259	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-piridazinilo
1260	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-cloro-2-piridazinilo
1261	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-piridazinilo
1262	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-piridazinilo
1263	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-bromo-2-piridazinilo
1264	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-piridazinilo
1265	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-piridazinilo
1266	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metoxi-2-piridazinilo
1267	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-piridazinilo
1268	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-piridazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1269	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometoxi-2-piridazinilo
1270	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-piridazinilo
1271	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-piridazinilo
1272	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metil-2-piridazinilo
1273	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-piridazinilo
1274	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-piridazinilo
1275	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometil-2-piridazinilo
1276	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-piridazinilo
1277	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-piridazinilo
1278	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-ciano-2-piridazinilo
1279	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-piridazinilo
1280	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-piridazinilo
1281	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-nitro-2-piridazinilo
1282	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-piridazinilo
1283	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-piridazinilo
1284	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metanosulfonil-2-piridazinilo
1285	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-piridazinilo
1286	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-3-piridazinilo
1287	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-3-piridazinilo
1288	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-fluoro-3-piridazinilo
1289	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-3-piridazinilo
1290	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-3-piridazinilo
1291	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-cloro-3-piridazinilo
1292	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-3-piridazinilo
1293	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-3-piridazinilo
1294	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-bromo-3-piridazinilo
1295	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-3-piridazinilo
1296	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-3-piridazinilo
1297	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metoxi-3-piridazinilo
1298	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-3-piridazinilo
1299	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-3-piridazinilo
1300	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometoxi-3-piridazinilo
1301	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-3-piridazinilo
1302	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-3-piridazinilo
1303	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metil-3-piridazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1304	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-3-piridazinilo
1305	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-3-piridazinilo
1306	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometil-3-piridazinilo
1307	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-3-piridazinilo
1308	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-3-piridazinilo
1309	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-ciano-3-piridazinilo
1310	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-3-piridazinilo
1311	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-3-piridazinilo
1312	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-nitro-3-piridazinilo
1313	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-3-piridazinilo
1314	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-3-piridazinilo
1315	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metanosulfonil-3-piridazinilo
1316	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-pirimidilo
1317	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-pirimidilo
1318	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-pirimidilo
1319	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-pirimidilo
1320	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-pirimidilo
1321	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-pirimidilo
1322	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-pirimidilo
1323	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-pirimidilo
1324	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-pirimidilo
1325	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-pirimidilo
1326	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-pirimidilo
1327	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-pirimidilo
1328	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-pirimidilo
1329	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-pirimidilo
1330	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-pirimidilo
1331	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-pirimidilo
1332	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-pirimidilo
1333	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-pirimidilo
1334	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-pirimidilo
1335	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-pirimidilo
1336	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-pirimidilo
1337	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-pirimidilo
1338	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-4-pirimidilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1339	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-4-pirimidilo
1340	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-fluoro-4-pirimidilo
1341	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-4-pirimidilo
1342	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-4-pirimidilo
1343	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-cloro-4-pirimidilo
1344	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-4-pirimidilo
1345	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-4-pirimidilo
1346	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-bromo-4-pirimidilo
1347	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-4-pirimidilo
1348	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-4-pirimidilo
1349	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metoxi-4-pirimidilo
1350	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-4-pirimidilo
1351	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-4-pirimidilo
1352	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometoxi-4-pirimidilo
1353	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-4-pirimidilo
1354	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-4-pirimidilo
1355	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metil-4-pirimidilo
1356	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-4-pirimidilo
1357	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-4-pirimidilo
1358	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometil-4-pirimidilo
1359	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-4-pirimidilo
1360	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-4-pirimidilo
1361	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-ciano-4-pirimidilo
1362	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-4-pirimidilo
1363	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-4-pirimidilo
1364	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-nitro-4-pirimidilo
1365	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-4-pirimidilo
1366	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-4-pirimidilo
1367	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metanosulfonil-4-pirimidilo
1368	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-pirimidilo
1369	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-5-pirimidilo
1370	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-5-pirimidilo
1371	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-5-pirimidilo
1372	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-5-pirimidilo
1373	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-5-pirimidilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1374	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-5-pirimidilo
1375	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-5-pirimidilo
1376	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-5-pirimidilo
1377	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-5-pirimidilo
1378	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-5-pirimidilo
1379	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-5-pirimidilo
1380	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-5-pirimidilo
1381	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-5-pirimidilo
1382	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-5-pirimidilo
1383	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-5-pirimidilo
1384	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-5-pirimidilo
1385	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-5-pirimidilo
1386	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-5-pirimidilo
1387	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-5-pirimidilo
1388	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-5-pirimidilo
1389	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-pirazinilo
1390	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-2-pirazinilo
1391	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-pirazinilo
1392	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-fluoro-2-pirazinilo
1393	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-2-pirazinilo
1394	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-pirazinilo
1395	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-cloro-2-pirazinilo
1396	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-bromo-2-pirazinilo
1397	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-pirazinilo
1398	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-bromo-2-pirazinilo
1399	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-2-pirazinilo
1400	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-pirazinilo
1401	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metoxi-2-pirazinilo
1402	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-2-pirazinilo
1403	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-pirazinilo
1404	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometoxi-2-pirazinilo
1405	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-2-pirazinilo
1406	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-pirazinilo
1407	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metil-2-pirazinilo
1408	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-2-pirazinilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1409	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-pirazinilo
1410	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-trifluorometil-2-pirazinilo
1411	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-2-pirazinilo
1412	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-pirazinilo
1413	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-ciano-2-pirazinilo
1414	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-2-pirazinilo
1415	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-pirazinilo
1416	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-nitro-2-pirazinilo
1417	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metilsulfonato-2-pirazinilo
1418	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metilsulfonato-2-pirazinilo
1419	H	CH ₃	CH ₃	H	H	6-metilsulfonato-2-pirazinilo
1420	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-furanilo
1421	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-2-furanilo
1422	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-furanilo
1423	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-furanilo
1424	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-2-furanilo
1425	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-furanilo
1426	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-furanilo
1427	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-bromo-2-furanilo
1428	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-furanilo
1429	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-furanilo
1430	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-2-furanilo
1431	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-furanilo
1432	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-furanilo
1433	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-2-furanilo
1434	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-furanilo
1435	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-furanilo
1436	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-2-furanilo
1437	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-furanilo
1438	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-furanilo
1439	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-2-furanilo
1440	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-furanilo
1441	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-furanilo
1442	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-2-furanilo
1443	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1444	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-furanilo
1445	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-2-furanilo
1446	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-furanilo
1447	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-furanilo
1448	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metanosulfonil-2-furanilo
1449	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-furanilo
1450	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-furanilo
1451	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-furanilo
1452	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-2-furanilo
1453	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-furanilo
1454	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-furanilo
1455	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-2-furanilo
1456	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-furanilo
1457	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-furanilo
1458	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-bromo-2-furanilo
1459	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-furanilo
1460	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-furanilo
1461	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-2-furanilo
1462	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-furanilo
1463	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-furanilo
1464	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-2-furanilo
1465	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-furanilo
1466	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-furanilo
1467	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-2-furanilo
1468	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-furanilo
1469	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-furanilo
1470	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-2-furanilo
1471	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-furanilo
1472	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-furanilo
1473	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-2-furanilo
1474	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-furanilo
1475	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-furanilo
1476	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-2-furanilo
1477	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-furanilo
1478	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-furanilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1479	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metanosulfonil-2-furanilo
1480	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-furanilo
1481	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-furanilo
1482	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-furanilo
1483	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-3-furanilo
1484	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-3-furanilo
1485	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-3-furanilo
1486	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-3-furanilo
1487	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-3-furanilo
1488	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-3-furanilo
1489	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-3-furanilo
1490	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-3-furanilo
1491	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-3-furanilo
1492	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-3-furanilo
1493	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-3-furanilo
1494	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-3-furanilo
1495	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-3-furanilo
1496	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-3-furanilo
1497	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-3-furanilo
1498	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-3-furanilo
1499	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-3-furanilo
1500	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-3-furanilo
1501	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-3-furanilo
1502	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-3-furanilo
1503	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-3-furanilo
1504	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-3-furanilo
1505	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-3-furanilo
1506	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-3-furanilo
1507	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-3-furanilo
1508	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-3-furanilo
1509	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-3-furanilo
1510	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-3-furanilo
1511	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-3-furanilo
1512	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-3-furanilo
1513	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1514	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-2-tiofenilo
1515	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-tiofenilo
1516	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-tiofenilo
1517	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-2-tiofenilo
1518	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-tiofenilo
1519	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-tiofenilo
1520	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-bromo-2-tiofenilo
1521	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-tiofenilo
1522	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-tiofenilo
1523	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-2-tiofenilo
1524	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-tiofenilo
1525	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-tiofenilo
1526	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-2-tiofenilo
1527	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiofenilo
1528	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiofenilo
1529	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-2-tiofenilo
1530	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-tiofenilo
1531	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-tiofenilo
1532	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-2-tiofenilo
1533	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-tiofenilo
1534	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-tiofenilo
1535	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-2-tiofenilo
1536	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-tiofenilo
1537	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-tiofenilo
1538	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-2-tiofenilo
1539	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-tiofenilo
1540	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-tiofenilo
1541	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metanosulfonil-2-tiofenilo
1542	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-tiofenilo
1543	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosufonil-2-tiofenilo
1544	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-tiofenilo
1545	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-fluoro-2-tiofenilo
1546	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-tiofenilo
1547	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-tiofenilo
1548	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-cloro-2-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1549	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-tiofenilo
1550	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-tiofenilo
1551	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-bromo-2-tiofenilo
1552	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-tiofenilo
1553	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-tiofenilo
1554	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metoxi-2-tiofenilo
1555	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-tiofenilo
1556	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-tiofenilo
1557	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometoxi-2-tiofenilo
1558	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiofenilo
1559	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiofenilo
1560	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-2-tiofenilo
1561	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-tiofenilo
1562	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-tiofenilo
1563	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-trifluorometil-2-tiofenilo
1564	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-tiofenilo
1565	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-tiofenilo
1566	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-ciano-2-tiofenilo
1567	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-tiofenilo
1568	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-tiofenilo
1569	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-nitro-2-tiofenilo
1570	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-tiofenilo
1571	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-tiofenilo
1572	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metanosulfonil-2-tiofenilo
1573	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-tiofenilo
1574	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-tiofenilo
1575	H	CH ₃	CH ₃	H	H	3-tiofenilo
1576	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-3-tiofenilo
1577	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-3-tiofenilo
1578	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-3-tiofenilo
1579	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-3-tiofenilo
1580	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-3-tiofenilo
1581	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-3-tiofenilo
1582	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-3-tiofenilo
1583	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-3-tiofenilo

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1584	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-3-tiofenilo
1585	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-3-tiofenilo
1586	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-3-tiofenilo
1587	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-3-tiofenilo
1588	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-3-tiofenilo
1589	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-3-tiofenilo
1590	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-3-tiofenilo
1591	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-3-tiofenilo
1592	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-3-tiofenilo
1593	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-3-tiofenilo
1594	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-3-tiofenilo
1595	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-3-tiofenilo
1596	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-3-tiofenilo
1597	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-3-tiofenilo
1598	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-3-tiofenilo
1599	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-3-tiofenilo
1600	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-3-tiofenilo
1601	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-3-tiofenilo
1602	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-3-tiofenilo
1603	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-3-tiofenilo
1604	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-3-tiofenilo
1605	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-3-tiofenilo
1606	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ozaxol
1607	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-ozaxol
1608	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-ozaxol
1609	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-ozaxol
1610	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-ozaxol
1611	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-ozaxol
1612	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-ozaxol
1613	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-ozaxol
1614	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-ozaxol
1615	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-ozaxol
1616	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-ozaxol
1617	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-ozaxol
1618	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-ozaxol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1619	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-ozaxol
1620	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-ozaxol
1621	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-ozaxol
1622	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-ozaxol
1623	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-ozaxol
1624	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-ozaxol
1625	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-ozaxol
1626	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-ozaxol
1627	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ozaxol
1628	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-4-ozaxol
1629	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-4-ozaxol
1630	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-4-ozaxol
1631	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-4-ozaxol
1632	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-4-ozaxol
1633	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-4-ozaxol
1634	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-4-ozaxol
1635	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-4-ozaxol
1636	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-4-ozaxol
1637	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-4-ozaxol
1638	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-4-ozaxol
1639	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-4-ozaxol
1640	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-4-ozaxol
1641	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-4-ozaxol
1642	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-4-ozaxol
1643	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-4-ozaxol
1644	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-4-ozaxol
1645	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-4-ozaxol
1646	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-4-ozaxol
1647	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-4-ozaxol
1648	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ozaxol
1649	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-5-ozaxol
1650	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-5-ozaxol
1651	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-5-ozaxol
1652	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-5-ozaxol
1653	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-5-ozaxol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1654	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-5-ozaxol
1655	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-5-ozaxol
1656	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-5-ozaxol
1657	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-5-ozaxol
1658	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-5-ozaxol
1659	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-5-ozaxol
1660	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-5-ozaxol
1661	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-5-ozaxol
1662	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-5-ozaxol
1663	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-5-ozaxol
1664	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-5-ozaxol
1665	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-5-ozaxol
1666	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-5-ozaxol
1667	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-5-ozaxol
1668	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-5-ozaxol
1669	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-tiazol
1670	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-2-tiazol
1671	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-2-tiazol
1672	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-2-tiazol
1673	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-2-tiazol
1674	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-2-tiazol
1675	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-2-tiazol
1676	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-2-tiazol
1677	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-2-tiazol
1678	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-2-tiazol
1679	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-2-tiazol
1680	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-2-tiazol
1681	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-2-tiazol
1682	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-2-tiazol
1683	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-2-tiazol
1684	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-2-tiazol
1685	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-2-tiazol
1686	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-2-tiazol
1687	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-2-tiazol
1688	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-2-tiazol

ES 2 553 417 T3

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1689	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-2-tiazol
1690	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-tiazol
1691	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-4-tiazol
1692	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-fluoro-4-tiazol
1693	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-4-tiazol
1694	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-cloro-4-tiazol
1695	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-4-tiazol
1696	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-bromo-4-tiazol
1697	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-4-tiazol
1698	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metoxi-4-tiazol
1699	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-4-tiazol
1700	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometoxi-4-tiazol
1701	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-4-tiazol
1702	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metil-4-tiazol
1703	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-4-tiazol
1704	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-trifluorometil-4-tiazol
1705	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-4-tiazol
1706	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-ciano-4-tiazol
1707	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-4-tiazol
1708	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-nitro-4-tiazol
1709	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-4-tiazol
1710	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-metanosulfonil-4-tiazol
1711	H	CH ₃	CH ₃	H	H	5-tiazol
1712	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-fluoro-5-tiazol
1713	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-fluoro-5-tiazol
1714	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-cloro-5-tiazol
1715	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-cloro-5-tiazol
1716	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-bromo-5-tiazol
1717	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-bromo-5-tiazol
1718	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metoxi-5-tiazol
1719	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metoxi-5-tiazol
1720	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometoxi-5-tiazol
1721	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometoxi-5-tiazol
1722	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metil-5-tiazol
1723	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metil-5-tiazol

Compuesto número	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	HetAr
1724	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-trifluorometil-5-tiazol
1725	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-trifluorometil-5-tiazol
1726	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-ciano-5-tiazol
1727	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-ciano-5-tiazol
1728	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-nitro-5-tiazol
1729	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-nitro-5-tiazol
1730	H	CH ₃	CH ₃	H	H	2-metanosulfonil-5-tiazol
1731	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-metanosulfonil-5-tiazol

La Tabla 2 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹, R² y R⁴ son metilo y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

5 La Tabla 3 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo y R² es cloruro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 4 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo y R² es cloruro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 5 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R² son metilo y R⁴ es cloruro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

10 La Tabla 6 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo y R² es bromuro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 7 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es bromuro, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

15 La Tabla 8 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² es cloruro, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 9 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² es bromuro, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 10 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R² son metilo, R⁴ es etenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

20 La Tabla 11 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es etenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 12 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R² son metilo, R⁴ es etenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

25 La Tabla 13 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 14 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-fluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 15 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-cloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

30 La Tabla 16 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-trifluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 17 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 4-fluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.

35 La Tabla 18 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 4-cloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.

- La Tabla 19 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 4-trifluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- La Tabla 20 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- 5 La Tabla 21 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- La Tabla 22 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- 10 La Tabla 23 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- La Tabla 24 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 4-cloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- La Tabla 25 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 4-bromo-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en La Tabla 1.
- 15 La Tabla 26 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 4-difluorometoxi-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 27 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 2-fluoro-4-cloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- 20 La Tabla 28 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 2,4-dicloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 29 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es metilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 2-metil-4-dicloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 30 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son metilo y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- 25 La Tabla 31 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo y R² es cloruro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 32 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo y R² es cloruro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- 30 La Tabla 33 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² es metilo y R⁴ es cloruro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 34 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo y R² es bromuro y R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 35 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es bromuro, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- 35 La Tabla 36 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² es cloruro, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 37 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² es bromuro, R³ es hidrógeno, R⁴ es metoxi y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- 40 La Tabla 38 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 39 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ son metilo, R² es etenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- La Tabla 40 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.
- 45 La Tabla 41 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 42 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 43 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

- 5 La Tabla 44 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-trifluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 45 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-fluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

- 10 La Tabla 46 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-cloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 47 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-trifluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 48 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

- 15 La Tabla 49 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 50 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

- 20 La Tabla 51 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, R³ es hidrógeno y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 52 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 4-cloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 53 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 4-bromo-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

- 25 La Tabla 54 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 4-difluorometoxi-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 55 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 2-fluoro-4-cloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

- 30 La Tabla 56 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 2,4-dicloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 57 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ es etilo, R² y R⁴ son hidrógeno y R³ es 2-metil-4-dicloro-fenilo y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

La Tabla 58 cubre 1731 compuestos del tipo estructural T-1, en los que R¹ y R⁴ es etilo, R² es metilo y R³ es hidrógeno R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y HetAr son como se definen en la Tabla 1.

35 Ejemplos biológicos

Se siembran en macetas en suelo estándar semillas de una variedad de especies de ensayo. Después de cultivar durante un día (pre-emergencia) o después de 8 días de cultivo (post-emergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizan con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del ingrediente activo calidad técnica en una disolución de acetona/agua (50:50) que contiene 0,5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxietileno, n° de registro de CAS 9005-64-5).

- 40

A continuación, las plantas de ensayo se hacen crecer en un invernadero en condiciones controladas (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se riegan dos veces al día. El ensayo se evalúa después de 13 días pre- y post-emergencia (100 = daño total a la planta; 0 = ningún daño a la planta).

- 45 Plantas de ensayo:

Lolium perenne (LOLPE), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Avena fatua* (AVEFA).

Actividad post-emergencia

ES 2 553 417 T3

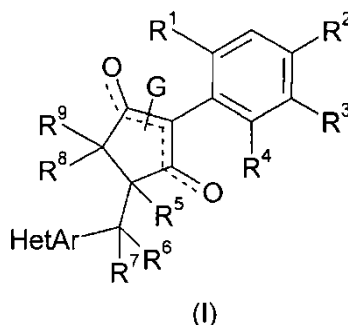
Compuesto número	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T2	250	80	60	80	20
T3	250	90	90	80	80
T4	250	50	40	30	20
T8	250	30	10	30	0

Actividad pre-emergencia

Compuesto número	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T2	250	80	30	0	20
T3	250	100	100	80	70
P1	250	40	0	0	0
P2	250	90	0	0	0

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I



en la que

5 G es hidrógeno o un metal agrícolamente aceptable, sulfonio, amonio o grupo protector,

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

R² y R³ son, cada uno independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂, haloalcoxi de C₁-C₂, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido,

10 y en la que, en R² y R³, cuando están presentes, los susituyentes opcionales en el arilo se seleccionan, independientemente, de: halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo (C₁-C₆), alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), cicloalqueno de C₅-7 (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, alcoxi de C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), tri-alquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi de C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi de C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆), cicloalquil C₃-C₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), alqueno C₃-C₁₀-oxi, alquil C₃-C₁₀-oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀-tio, haloalquil C₁-C₁₀-tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio, cicloalquil C₃-C₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)silil-alquil (C₁-C₆)tio, ariltio, alquil C₁-C₆-sulfonio, haloalquil C₁-C₆-sulfonio, alquil C₁-C₆-sulfino, haloalquil C₁-C₆-sulfino, arilsulfonio, tri-alquil (C₁-C₄)sililo, arildi-alquil (C₁-C₄)sililo, alquil C₁-C₄-diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁-C₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi de C₁-C₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi C₁-C₃)-aminocarbonilo, alquil C₁-C₆-carboniloxi, arilcarboniloxi, di-alquil (C₁-C₆)-aminocarboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆-amino, di-alquil (C₁-C₆)-amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)-amino, o arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆);

o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico se ciclan para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 5, 6 o 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C₁-C₆;

35 y en la que, en R² y R³, cuando están presentes, el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfino o alquil C₁-C₃-sulfonio;

R⁴ es metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂, y

40 R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, haloalqueno C₃-C₆-oxi, alquil C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfino, alquil C₁-C₆-sulfonio, alcoxi de C₁-C₆-sulfonio, haloalcoxi de C₁-C₆-sulfonio, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfino o alquil C₁-C₃-sulfonio, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfino o alquil C₁-C₃-sulfonio, o

R⁶ y R⁷ o R⁸ y R⁹, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico opcionalmente sustituido o un heterocicli opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₆ o haloalquilo de C₁-C₆; y en el que "anillo carbocíclico" significa un grupo cicloalquilo o cicloalqueno; y en el que, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalqueno con alquilo de C₁-C₃; o

5 R⁵ y R⁶ forman juntos un enlace, y

HetAr es un heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo;

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

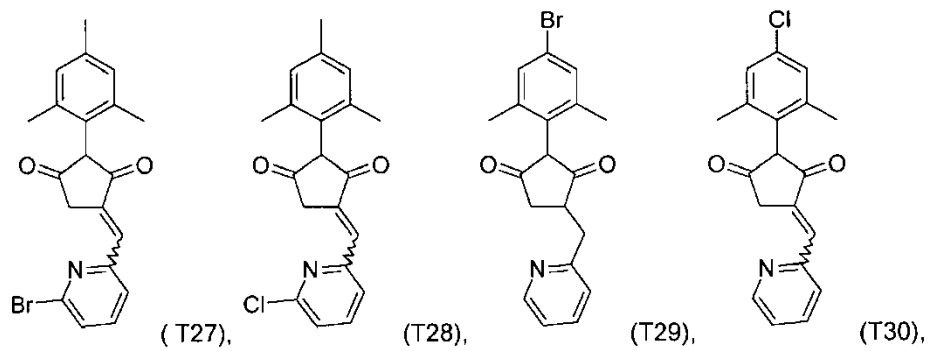
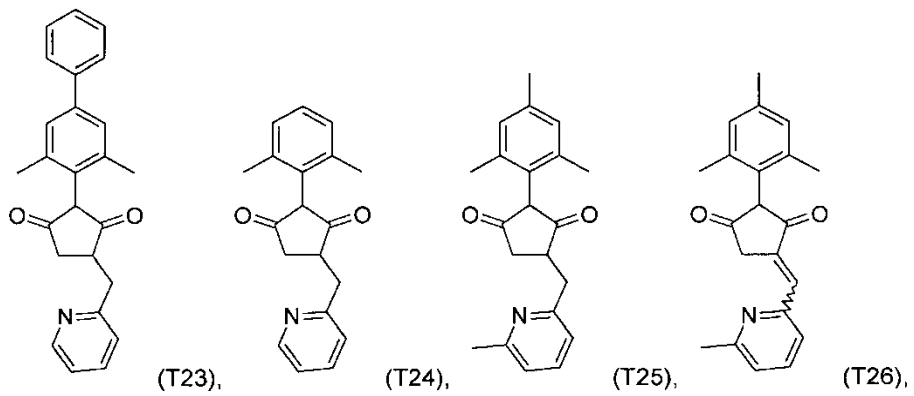
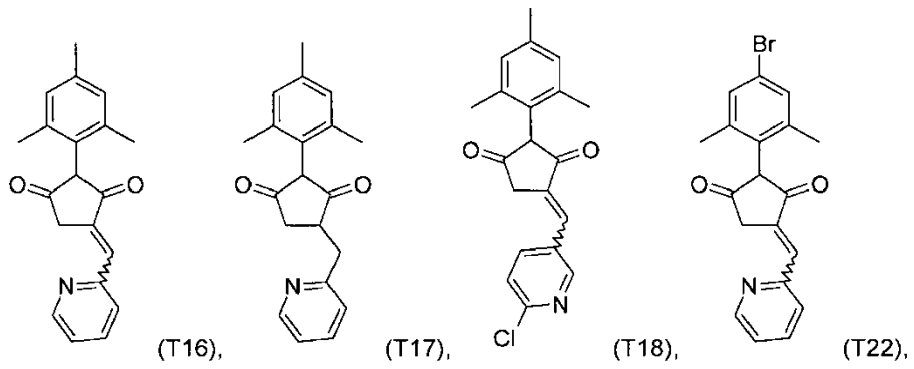
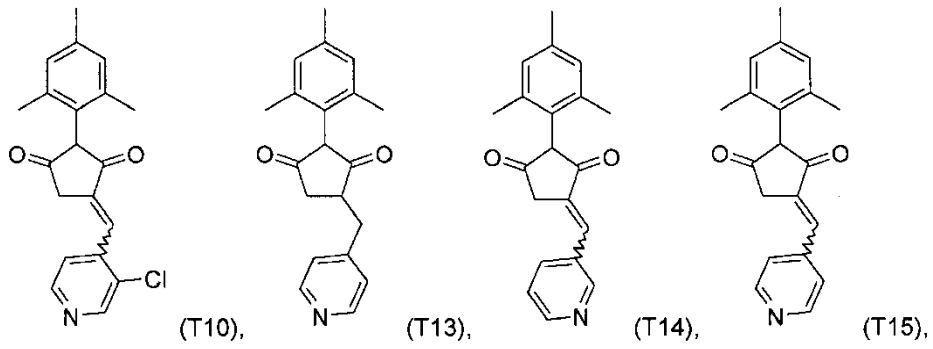
15 en los que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son, cada uno independientemente entre sí, oxígeno o azufre; y en los que

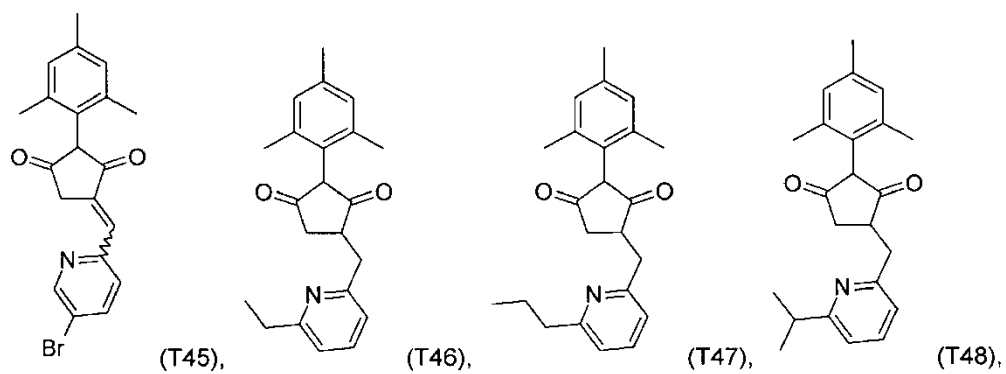
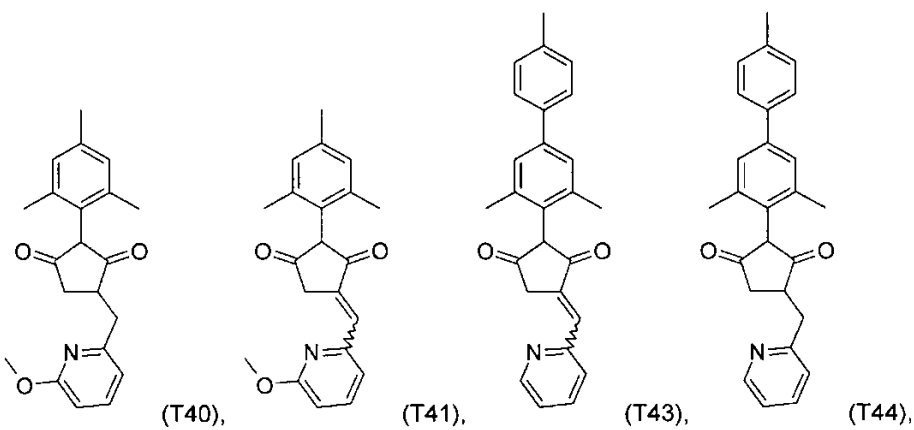
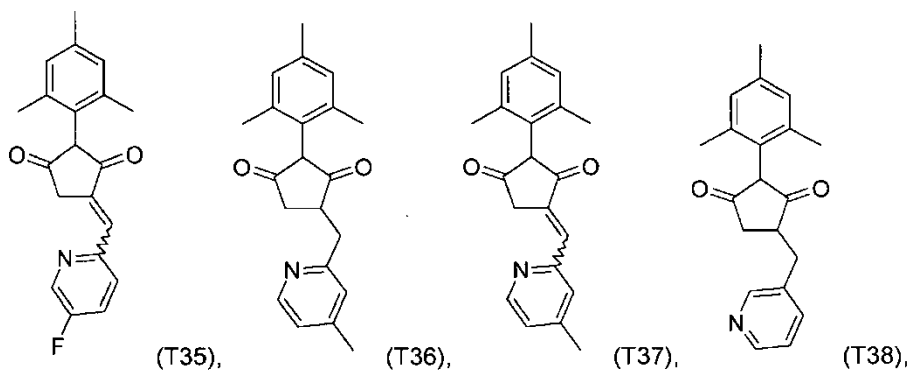
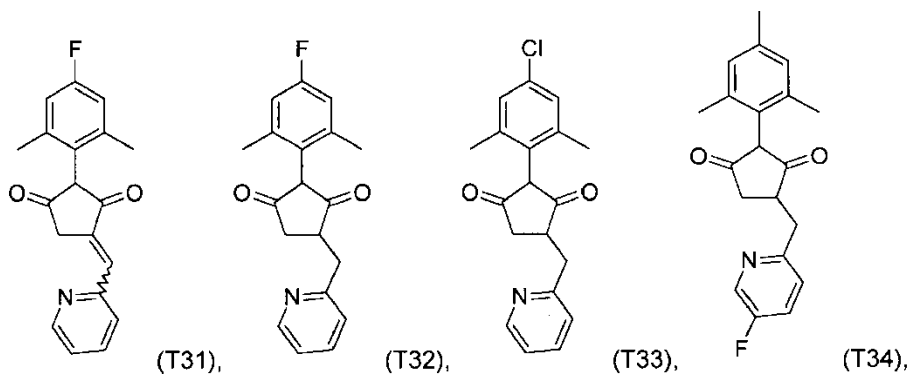
R^a es H, alquilo de C₁-C₁₈, alqueno de C₂-C₁₈, alquino de C₂-C₁₈, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alqueno C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)-amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆-sillil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalqueno de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

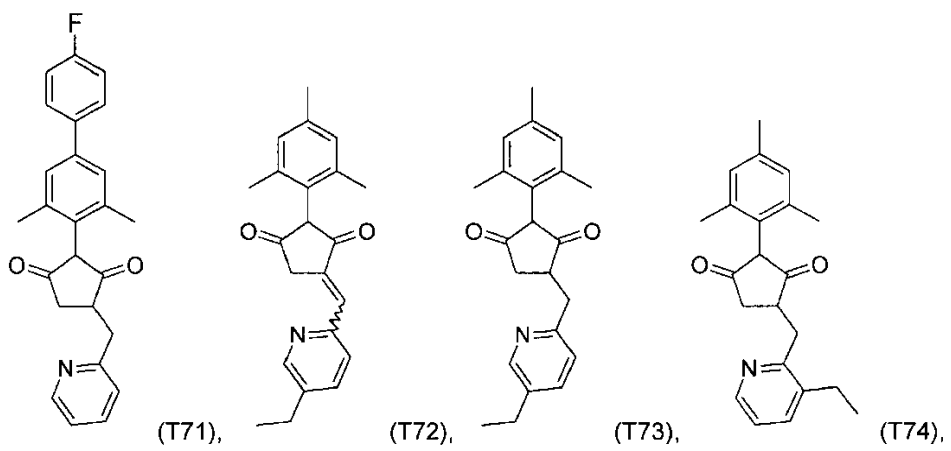
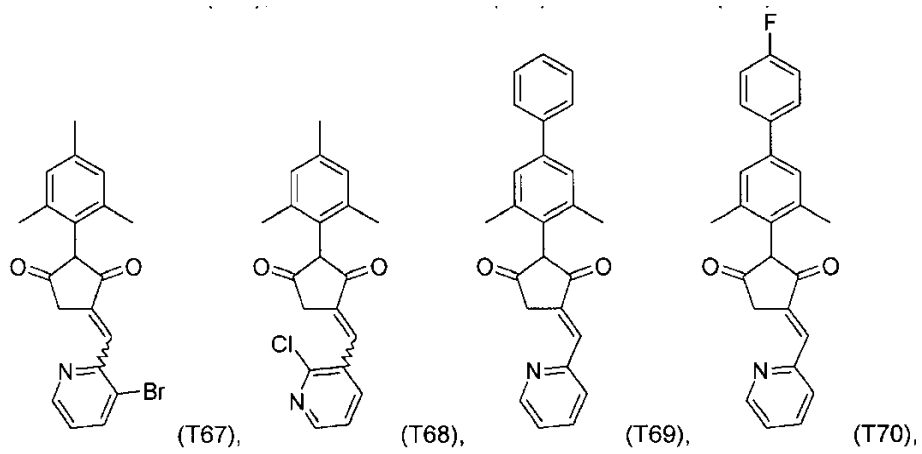
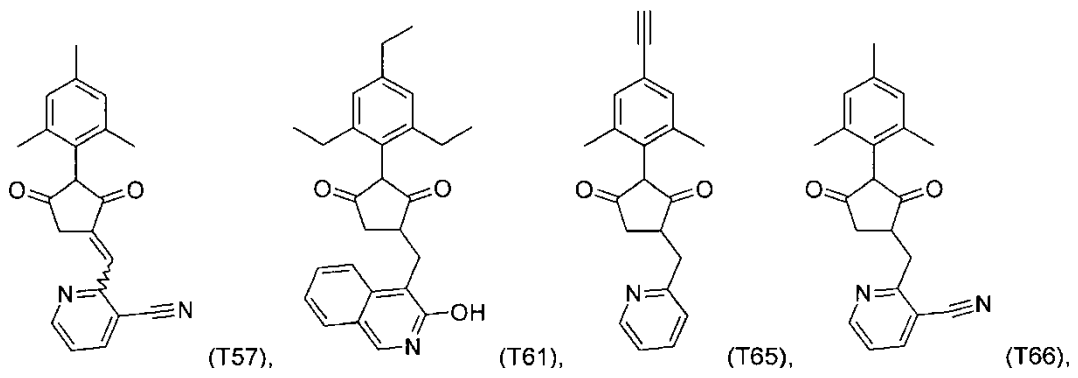
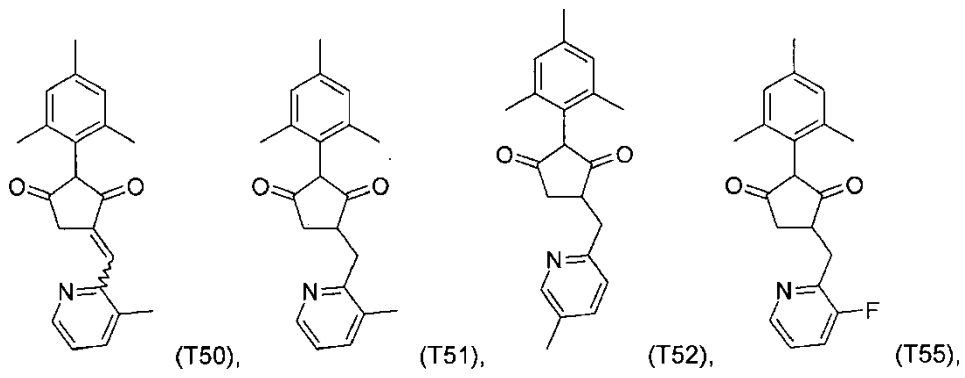
20 R^b es alquilo de C₁-C₁₈, alqueno de C₃-C₁₈, alquino de C₃-C₁₈, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alqueno C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)-amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆-sillil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalqueno de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

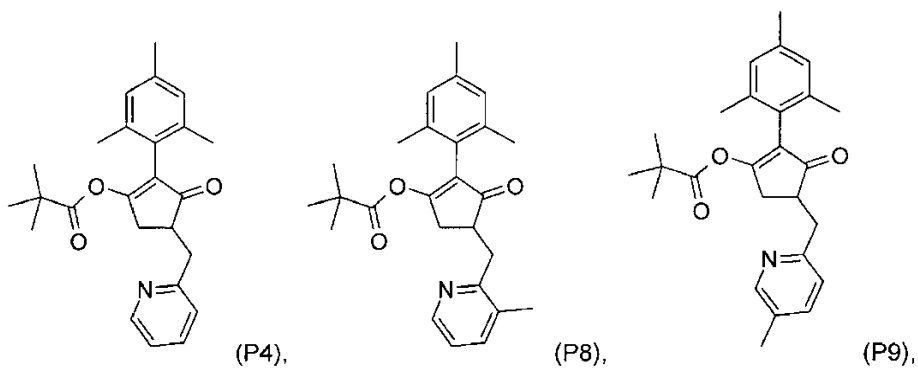
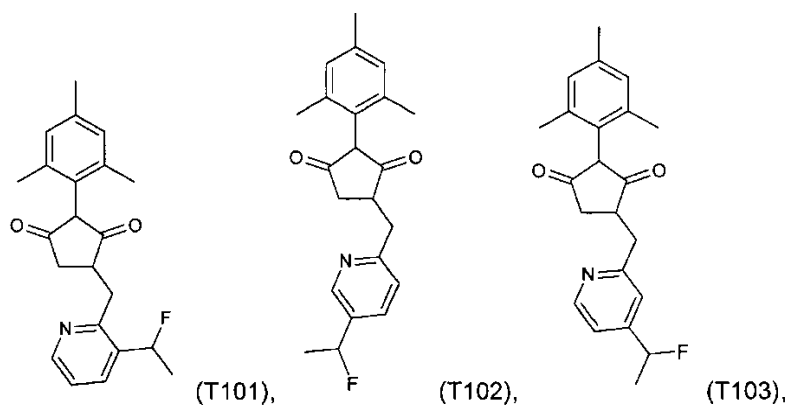
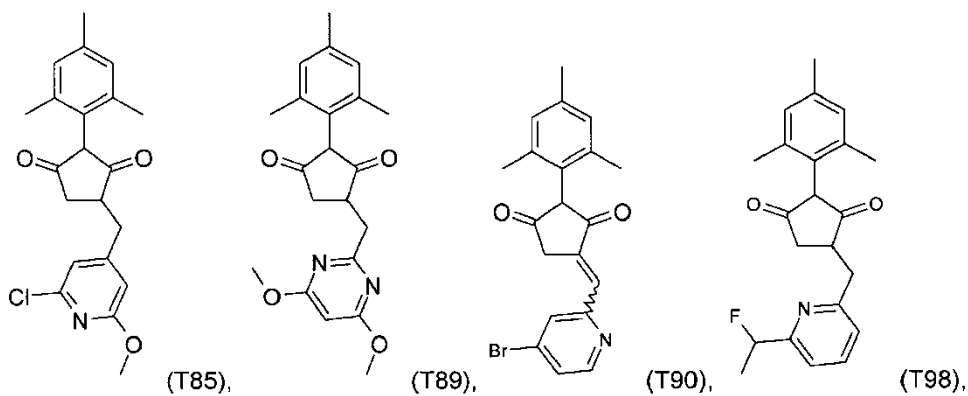
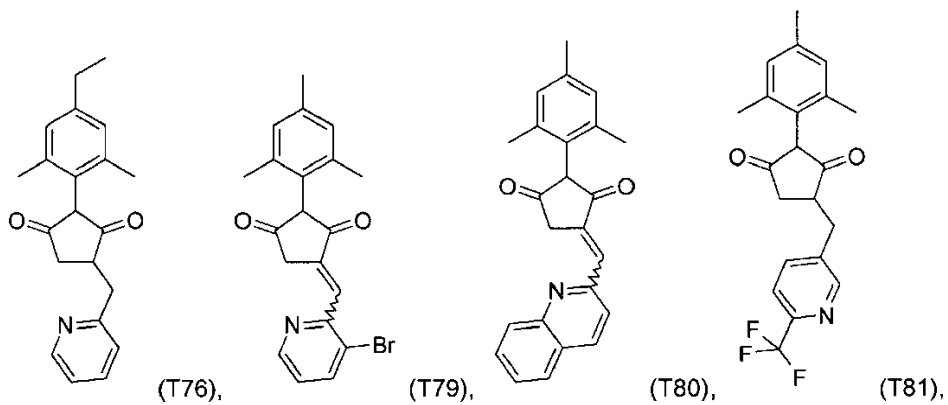
25 R^c y R^d son, cada uno independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo de C₁-C₁₀, alqueno de C₃-C₁₀, alquino de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alqueno C₃-C₅-oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi de C₁-C₅-carbonil-alquilo (C₁-C₅), amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈-amino-carbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅-carbonil-amino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)-carbonil-*N*-alquil (C₂-C₅)-aminoalquilo, trialquil C₃-C₆-sillil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalqueno de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilamino o heteroarilamino

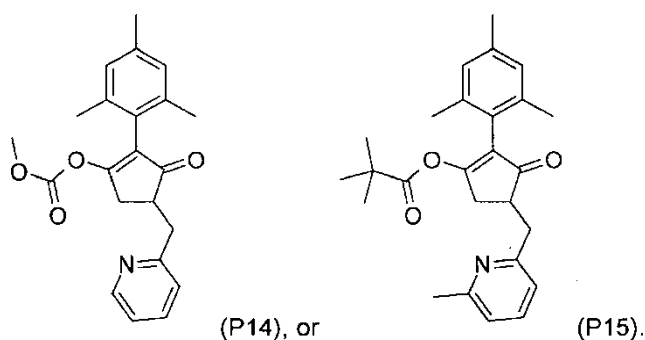
- C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxi(C₁-C₅)alquilo (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi(C₁-C₅)alquilo (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo, o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; y
- 5 en los que "arilo" significa fenilo;
- 10 en los que "heteroarilo" significa un anillo heteroarilo de 6 miembros que está opcionalmente benzanillado; y
- en los que "heterociclilo" significa un sistema anular monocíclico o bicíclico no aromático que contiene hasta 7 átomos, incluyendo uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N.
2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que "heteroarilo" significa piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo.
- 15 3. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que:
- "cicloalquilo" es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo;
- "cicloalquilalquilo" es ciclopropilmetilo; y
- "cicloalquenilo" es ciclopentenilo o ciclohexenilo.
4. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que
- 20 R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, vinilo, etinilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂;
- R² es metilo, halógeno, alcoxi de C₁-C₂ o haloalcoxi de C₁-C₂, o fenilo opcionalmente sustituido;
- R³ es hidrógeno;
- R⁴ es metilo, etilo, *n*-propilo, vinilo, etinilo o metoxi; y
- 25 R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquenilo de C₂-C₄, haloalquenilo de C₂-C₄ o alquinilo de C₂-C₄; o
- R⁶ y R⁷ o R⁸ y R⁹, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico opcionalmente sustituido como se define en la reivindicación 1 o un heterociclilo opcionalmente sustituido como se define en la reivindicación 1; o
- R⁵ y R⁶ forman juntos un enlace; y
- 30 HetAr es heteroarilo o heteroarilo sustituido una a tres veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
5. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
- R¹ es metilo o etilo, R² es metilo o cloro, R³ es hidrógeno, y R⁴ es metilo, etilo o metoxi, y R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, o R⁵ y R⁶ forman juntos un enlace; y
- 35 HetAr es un heteroarilo de 6 miembros o es un heteroarilo de 6 miembros que está sustituido una a tres veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
6. Un compuesto según la reivindicación 1, 4 o 5, en el que HetAr es piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo, en el que estos anillos están opcionalmente sustituidos una o dos veces con fluoro, cloro, bromo, metilo, metoxi, ciano o trifluorometilo.
- 40 7. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que, cuando G es un grupo protector, entonces G es un grupo -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b, y los significados de X^a, R^a, X^b, X^c y R^b son como se definen en la reivindicación 1.
8. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que G es hidrógeno.
9. Un compuesto según la reivindicación 1, el cual es uno de los siguientes compuestos:



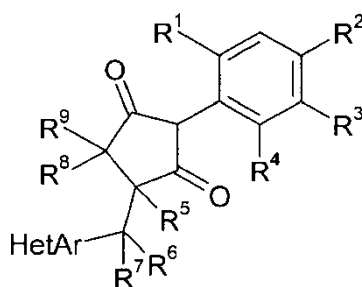








10. Un compuesto según la reivindicación 1, que es un compuesto de tipo estructural T-1:



T-1

en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son H; y

- 5 en la que HetAr es 2-piridilo, 3-fluoro-2-piridilo, 4-fluoro-2-piridilo, 5-fluoro-2-piridilo, 6-fluoro-2-piridilo, 3-cloro-2-piridilo, 4-cloro-2-piridilo, 5-cloro-2-piridilo, 6-cloro-2-piridilo, 3-metil-2-piridilo, 4-metil-2-piridilo, 5-metil-2-piridilo, 6-metil-2-piridilo, 3-trifluorometil-2-piridilo, 4-trifluorometil-2-piridilo, 5-trifluorometil-2-piridilo, 6-trifluorometil-2-piridilo, 3-metoxi-2-piridilo, 4-metoxi-2-piridilo, 5-metoxi-2-piridilo, 6-metoxi-2-piridilo, 3-trifluorometoxi-2-piridilo, 4-trifluorometoxi-2-piridilo, 5-trifluorometoxi-2-piridilo, 6-trifluorometoxi-2-piridilo, 3-ciano-2-piridilo, 4-ciano-2-piridilo, 5-ciano-2-piridilo, 6-ciano-2-piridilo, 3-nitro-2-piridilo, 4-nitro-2-piridilo, 5-nitro-2-piridilo, 6-nitro-2-piridilo, 3-metanosulfonyl-2-piridilo, 4-metanosulfonyl-2-piridilo, 5-metanosulfonyl-2-piridilo, 6-metanosulfonyl-2-piridilo, 3-piridilo, 2-fluoro-3-piridilo, 4-fluoro-3-piridilo, 5-fluoro-3-piridilo, 6-fluoro-3-piridilo, 2-cloro-3-piridilo, 4-cloro-3-piridilo, 5-cloro-3-piridilo, 6-cloro-3-piridilo, 2-bromo-3-piridilo, 4-bromo-3-piridilo, 5-bromo-3-piridilo, 6-bromo-3-piridilo, 2-metoxi-3-piridilo, 4-metoxi-3-piridilo, 5-metoxi-3-piridilo, 6-metoxi-3-piridilo, 2-trifluorometoxi-3-piridilo, 4-trifluorometoxi-3-piridilo, 5-trifluorometoxi-3-piridilo, 6-trifluorometoxi-3-piridilo, 2-metil-3-piridilo, 4-metil-3-piridilo, 5-metil-3-piridilo, 6-metil-3-piridilo, 2-trifluorometil-3-piridilo, 4-trifluorometil-3-piridilo, 5-trifluorometil-3-piridilo, 6-trifluorometil-3-piridilo, 2-ciano-3-piridilo, 4-ciano-3-piridilo, 5-ciano-3-piridilo, 6-ciano-3-piridilo, 2-nitro-3-piridilo, 4-nitro-3-piridilo, 5-nitro-3-piridilo, 6-nitro-3-piridilo, 2-metanosulfonyl-3-piridilo, 4-metanosulfonyl-3-piridilo, 5-metanosulfonyl-3-piridilo, 6-metanosulfonyl-3-piridilo, 4-piridilo, 2-fluoro-4-piridilo, 3-fluoro-4-piridilo, 2-cloro-4-piridilo, 3-cloro-4-piridilo, 2-bromo-4-piridilo, 3-bromo-4-piridilo, 2-metoxi-4-piridilo, 3-metoxi-4-piridilo, 2-trifluorometoxi-4-piridilo, 3-trifluorometoxi-4-piridilo, 2-metil-4-piridilo, 3-metil-4-piridilo, 2-trifluorometil-4-piridilo, 3-trifluorometil-4-piridilo, 2-ciano-4-piridilo, 3-ciano-4-piridilo, 2-nitro-4-piridilo, 3-nitro-4-piridilo, 2-metanosulfonyl-4-piridilo, 3-metanosulfonyl-4-piridilo, 2-piridazinilo, 4-fluoro-2-piridazinilo, 5-fluoro-2-piridazinilo, 6-fluoro-2-piridazinilo, 4-cloro-2-piridazinilo, 5-cloro-2-piridazinilo, 6-cloro-2-piridazinilo, 4-bromo-2-piridazinilo, 5-bromo-2-piridazinilo, 6-bromo-2-piridazinilo, 4-metoxi-2-piridazinilo, 5-metoxi-2-piridazinilo, 6-metoxi-2-piridazinilo, 4-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 5-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 6-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 4-metil-2-piridazinilo, 5-metil-2-piridazinilo, 6-metil-2-piridazinilo, 4-trifluorometil-2-piridazinilo, 5-trifluorometil-2-piridazinilo, 6-trifluorometil-2-piridazinilo, 4-ciano-2-piridazinilo, 5-ciano-2-piridazinilo, 6-ciano-2-piridazinilo, 4-nitro-2-piridazinilo, 5-nitro-2-piridazinilo, 6-nitro-2-piridazinilo, 4-metanosulfonyl-2-piridazinilo, 5-metanosulfonyl-2-piridazinilo, 3-piridazinilo, 2-fluoro-3-piridazinilo, 5-fluoro-3-piridazinilo, 6-fluoro-3-piridazinilo, 2-cloro-3-piridazinilo, 5-cloro-3-piridazinilo, 6-cloro-3-piridazinilo, 2-bromo-3-piridazinilo, 5-bromo-3-piridazinilo, 6-bromo-3-piridazinilo, 2-metoxi-3-piridazinilo, 5-metoxi-3-piridazinilo, 6-metoxi-3-piridazinilo, 2-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 5-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 6-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 2-metil-3-piridazinilo, 5-metil-3-piridazinilo, 6-metil-3-piridazinilo, 2-trifluorometil-3-piridazinilo, 5-trifluorometil-3-piridazinilo, 6-trifluorometil-3-piridazinilo, 2-ciano-3-piridazinilo, 5-ciano-3-piridazinilo, 6-ciano-3-piridazinilo, 2-nitro-3-piridazinilo, 5-nitro-3-piridazinilo, 6-nitro-3-piridazinilo, 2-metanosulfonyl-3-piridazinilo, 5-metanosulfonyl-3-piridazinilo, 6-metanosulfonyl-3-piridazinilo, 2-pirimidilo, 4-fluoro-2-pirimidilo, 5-fluoro-2-pirimidilo, 4-cloro-2-pirimidilo, 5-cloro-2-pirimidilo, 4-bromo-2-pirimidilo, 5-bromo-2-pirimidilo, 4-metoxi-2-pirimidilo, 5-metoxi-2-pirimidilo, 4-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 5-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 4-metil-2-pirimidilo, 5-metil-2-pirimidilo, 4-trifluorometil-2-pirimidilo, 5-trifluorometil-2-pirimidilo, 4-ciano-2-pirimidilo, 5-ciano-2-pirimidilo, 4-nitro-2-pirimidilo, 5-nitro-2-pirimidilo, 4-metanosulfonyl-2-pirimidilo, 5-metanosulfonyl-2-pirimidilo, 4-pirimidilo, 2-fluoro-4-pirimidilo, 5-fluoro-4-pirimidilo, 6-

5 fluoro-4-pirimidilo, 2-cloro-4-pirimidilo, 5-cloro-4-pirimidilo, 6-cloro-4-pirimidilo, 2-bromo-4-pirimidilo, 5-bromo-4-pirimidilo, 6-bromo-4-pirimidilo, 2-metoxi-4-pirimidilo, 5-metoxi-4-pirimidilo, 6-metoxi-4-pirimidilo, 2-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 5-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 6-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 2-metil-4-pirimidilo, 5-metil-4-pirimidilo, 6-metil-4-pirimidilo, 2-trifluorometil-4-pirimidilo, 5-trifluorometil-4-pirimidilo, 6-trifluorometil-4-pirimidilo, 2-ciano-4-pirimidilo, 5-ciano-4-pirimidilo, 6-ciano-4-pirimidilo, 2-nitro-4-pirimidilo, 5-nitro-4-pirimidilo, 6-nitro-4-pirimidilo, 2-metanosulfonyl-4-pirimidilo, 5-metanosulfonyl-4-pirimidilo, 6-metanosulfonyl-4-pirimidilo, 5-pirimidilo, 2-fluoro-5-pirimidilo, 4-fluoro-5-pirimidilo, 2-cloro-5-pirimidilo, 4-cloro-5-pirimidilo, 2-bromo-5-pirimidilo, 4-bromo-5-pirimidilo, 2-metoxi-5-pirimidilo, 4-metoxi-5-pirimidilo, 2-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 4-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 2-metil-5-pirimidilo, 4-metil-5-pirimidilo, 2-trifluorometil-5-pirimidilo, 4-trifluorometil-5-pirimidilo, 2-ciano-5-pirimidilo, 4-ciano-5-pirimidilo, 2-nitro-5-pirimidilo, 4-nitro-5-pirimidilo, 2-metanosulfonyl-5-pirimidilo, 4-metanosulfonyl-5-pirimidilo, 2-pirazinilo, 3-fluoro-2-pirazinilo, 5-fluoro-2-pirazinilo, 6-fluoro-2-pirazinilo, 3-cloro-2-pirazinilo, 5-cloro-2-pirazinilo, 6-cloro-2-pirazinilo, 3-bromo-2-pirazinilo, 5-bromo-2-pirazinilo, 6-bromo-2-pirazinilo, 3-metoxi-2-pirazinilo, 5-metoxi-2-pirazinilo, 6-metoxi-2-pirazinilo, 3-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 5-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 6-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 3-metil-2-pirazinilo, 5-metil-2-pirazinilo, 6-metil-2-pirazinilo, 3-trifluorometil-2-pirazinilo, 5-trifluorometil-2-pirazinilo, 6-trifluorometil-2-pirazinilo, 3-ciano-2-pirazinilo, 5-ciano-2-pirazinilo, 6-ciano-2-pirazinilo, 3-nitro-2-pirazinilo, 5-nitro-2-pirazinilo, 6-nitro-2-pirazinilo, 3-metilsulfonato-2-pirazinilo, 5-metilsulfonato-2-pirazinilo, o 6-metilsulfonato-2-pirazinilo;

y en la que:

- R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o
- 20 R^1 y R^2 son metilo, R^4 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es bromuro y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 es metilo, R^2 es cloruro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o
- R^1 es metilo, R^2 es bromuro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o
- R^1 y R^2 son metilo, R^4 es etenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- 25 R^1 y R^4 son metilo, R^2 es etinilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^2 son metilo, R^4 es etinilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-fluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-cloro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- 30 R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-trifluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 4-fluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 4-cloro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 4-trifluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3,4-difluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- 35 R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3,4-dicloro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 es etilo, R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 es etilo, R^4 es metilo, R^2 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o
- 40 R^1 es etilo, R^2 es metilo, R^4 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 es etilo, R^4 es metilo, R^2 es bromuro y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 es etilo, R^2 es cloruro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o
- R^1 es etilo, R^2 es bromuro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o

R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ son metilo, R² es etenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es fenilo, y R³ es hidrógeno; o

5 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

10 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

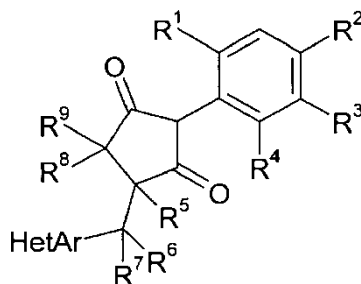
R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o

15 R¹ y R⁴ es etilo, R² es metilo y R³ es hidrógeno.

11. Un compuesto según la reivindicación 1, el cual es un compuesto de tipo estructural T-1:



T-1

en el que R⁵ es H,

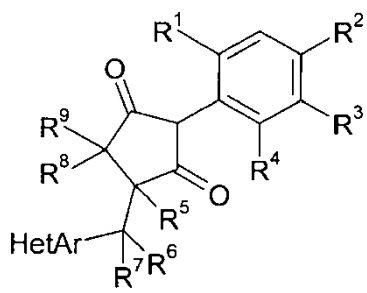
R⁶ es CH₃, y

20 R⁷, R⁸ y R⁹ son H; y

en el que HetAr es 2-piridilo, 3-fluoro-2-piridilo, 4-fluoro-2-piridilo, 5-fluoro-2-piridilo, 6-fluoro-2-piridilo, 3-cloro-2-piridilo, 4-cloro-2-piridilo, 5-cloro-2-piridilo, 6-cloro-2-piridilo, 3-metil-2-piridilo, 4-metil-2-piridilo, 5-metil-2-piridilo, 6-metil-2-piridilo, 3-trifluorometil-2-piridilo, 4-trifluorometil-2-piridilo, 5-trifluorometil-2-piridilo, 6-trifluorometil-2-piridilo, 3-metoxi-2-piridilo, 4-metoxi-2-piridilo, 5-metoxi-2-piridilo, 6-metoxi-2-piridilo, 3-trifluorometoxi-2-piridilo, 4-trifluorometoxi-2-piridilo, 5-trifluorometoxi-2-piridilo, 6-trifluorometoxi-2-piridilo, 3-ciano-2-piridilo, 4-ciano-2-piridilo, 5-ciano-2-piridilo, 6-ciano-2-piridilo, 3-nitro-2-piridilo, 4-nitro-2-piridilo, 5-nitro-2-piridilo, 6-nitro-2-piridilo, 3-metanosulfonil-2-piridilo, 4-metanosulfonil-2-piridilo, 5-metanosulfonil-2-piridilo, 6-metanosulfonil-2-piridilo, 3-piridilo, 2-fluoro-3-piridilo, 4-fluoro-3-piridilo, 5-fluoro-3-piridilo, 6-fluoro-3-piridilo, 2-cloro-3-piridilo, 4-cloro-3-piridilo, 5-cloro-3-piridilo, 6-cloro-3-piridilo, 2-bromo-3-piridilo, 4-bromo-3-piridilo, 5-bromo-3-piridilo, 6-bromo-3-piridilo, 2-metoxi-3-piridilo, 4-metoxi-3-piridilo, 5-metoxi-3-piridilo, 6-metoxi-3-piridilo, 2-trifluorometoxi-3-piridilo, 4-trifluorometoxi-3-piridilo, 5-trifluorometoxi-3-piridilo, 6-trifluorometoxi-3-piridilo, 2-metil-3-piridilo, 4-metil-3-piridilo, 5-metil-3-piridilo, 6-metil-3-piridilo, 2-trifluorometil-3-piridilo, 4-trifluorometil-3-piridilo, 5-trifluorometil-3-piridilo, 6-trifluorometil-3-piridilo, 2-ciano-3-piridilo, 4-ciano-3-piridilo, 5-ciano-3-piridilo, 6-ciano-3-piridilo, 2-nitro-3-piridilo, 4-nitro-3-piridilo, 5-nitro-3-piridilo, 6-nitro-3-piridilo, 2-metanosulfonil-3-piridilo, 4-metanosulfonil-3-piridilo, 5-metanosulfonil-3-piridilo, 6-metanosulfonil-3-piridilo, 3-piridilo, 2-fluoro-4-piridilo, 3-fluoro-4-piridilo, 2-cloro-4-piridilo, 3-cloro-4-piridilo, 2-bromo-4-piridilo, 3-bromo-4-piridilo, 2-metoxi-4-piridilo, 3-metoxi-4-piridilo, 2-trifluorometoxi-4-piridilo, 3-trifluorometoxi-4-piridilo, 2-metil-4-piridilo, 3-metil-4-piridilo, 2-trifluorometil-4-piridilo, 3-trifluorometil-4-piridilo, 2-ciano-4-piridilo, 3-ciano-4-piridilo, 2-nitro-4-piridilo, 3-nitro-4-piridilo, 2-metanosulfonil-4-piridilo, 3-metanosulfonil-4-piridilo, 2-piridazinilo,

- 4-fluoro-2-piridazinilo, 5-fluoro-2-piridazinilo, 6-fluoro-2-piridazinilo, 4-cloro-2-piridazinilo, 5-cloro-2-piridazinilo, 6-cloro-2-piridazinilo, 4-bromo-2-piridazinilo, 5-bromo-2-piridazinilo, 6-bromo-2-piridazinilo, 4-metoxi-2-piridazinilo, 5-metoxi-2-piridazinilo, 6-metoxi-2-piridazinilo, 4-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 5-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 6-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 4-metil-2-piridazinilo, 5-metil-2-piridazinilo, 6-metil-2-piridazinilo, 4-trifluorometil-2-piridazinilo, 5-trifluorometil-2-piridazinilo, 6-trifluorometil-2-piridazinilo, 4-ciano-2-piridazinilo, 5-ciano-2-piridazinilo, 6-ciano-2-piridazinilo, 4-nitro-2-piridazinilo, 5-nitro-2-piridazinilo, 6-nitro-2-piridazinilo, 4-metanosulfonil-2-piridazinilo, 5-metanosulfonil-2-piridazinilo, 6-metanosulfonil-2-piridazinilo, 3-piridazinilo, 2-fluoro-3-piridazinilo, 5-fluoro-3-piridazinilo, 6-fluoro-3-piridazinilo, 2-cloro-3-piridazinilo, 5-cloro-3-piridazinilo, 6-cloro-3-piridazinilo, 2-bromo-3-piridazinilo, 5-bromo-3-piridazinilo, 6-bromo-3-piridazinilo, 2-metoxi-3-piridazinilo, 5-metoxi-3-piridazinilo, 6-metoxi-3-piridazinilo, 2-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 5-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 6-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 2-metil-3-piridazinilo, 5-metil-3-piridazinilo, 6-metil-3-piridazinilo, 2-trifluorometil-3-piridazinilo, 5-trifluorometil-3-piridazinilo, 6-trifluorometil-3-piridazinilo, 2-ciano-3-piridazinilo, 5-ciano-3-piridazinilo, 6-ciano-3-piridazinilo, 2-nitro-3-piridazinilo, 5-nitro-3-piridazinilo, 6-nitro-3-piridazinilo, 2-metanosulfonil-3-piridazinilo, 5-metanosulfonil-3-piridazinilo, 6-metanosulfonil-3-piridazinilo, 2-pirimidilo, 4-fluoro-2-pirimidilo, 5-fluoro-2-pirimidilo, 4-cloro-2-pirimidilo, 5-cloro-2-pirimidilo, 6-cloro-2-pirimidilo, 4-bromo-2-pirimidilo, 5-bromo-2-pirimidilo, 6-bromo-2-pirimidilo, 4-metoxi-2-pirimidilo, 5-metoxi-2-pirimidilo, 6-metoxi-2-pirimidilo, 4-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 5-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 6-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 4-metil-2-pirimidilo, 5-metil-2-pirimidilo, 6-metil-2-pirimidilo, 4-trifluorometil-2-pirimidilo, 5-trifluorometil-2-pirimidilo, 6-trifluorometil-2-pirimidilo, 4-ciano-2-pirimidilo, 5-ciano-2-pirimidilo, 4-nitro-2-pirimidilo, 5-nitro-2-pirimidilo, 6-nitro-2-pirimidilo, 4-metanosulfonil-2-pirimidilo, 5-metanosulfonil-2-pirimidilo, 4-pirimidilo, 2-fluoro-4-pirimidilo, 5-fluoro-4-pirimidilo, 6-fluoro-4-pirimidilo, 2-cloro-4-pirimidilo, 5-cloro-4-pirimidilo, 6-cloro-4-pirimidilo, 2-bromo-4-pirimidilo, 5-bromo-4-pirimidilo, 6-bromo-4-pirimidilo, 2-metoxi-4-pirimidilo, 5-metoxi-4-pirimidilo, 6-metoxi-4-pirimidilo, 2-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 5-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 6-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 2-metil-4-pirimidilo, 5-metil-4-pirimidilo, 6-metil-4-pirimidilo, 2-trifluorometil-4-pirimidilo, 5-trifluorometil-4-pirimidilo, 6-trifluorometil-4-pirimidilo, 2-ciano-4-pirimidilo, 5-ciano-4-pirimidilo, 6-ciano-4-pirimidilo, 2-nitro-4-pirimidilo, 5-nitro-4-pirimidilo, 6-nitro-4-pirimidilo, 2-metanosulfonil-4-pirimidilo, 5-metanosulfonil-4-pirimidilo, 6-metanosulfonil-4-pirimidilo, 5-pirimidilo, 2-fluoro-5-pirimidilo, 4-fluoro-5-pirimidilo, 6-fluoro-5-pirimidilo, 2-cloro-5-pirimidilo, 4-cloro-5-pirimidilo, 6-cloro-5-pirimidilo, 2-bromo-5-pirimidilo, 4-bromo-5-pirimidilo, 5-bromo-5-pirimidilo, 2-metoxi-5-pirimidilo, 4-metoxi-5-pirimidilo, 5-metoxi-5-pirimidilo, 2-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 4-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 6-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 2-metil-5-pirimidilo, 4-metil-5-pirimidilo, 6-metil-5-pirimidilo, 2-trifluorometil-5-pirimidilo, 4-trifluorometil-5-pirimidilo, 6-trifluorometil-5-pirimidilo, 2-ciano-5-pirimidilo, 4-ciano-5-pirimidilo, 5-nitro-5-pirimidilo, 6-nitro-5-pirimidilo, 2-metanosulfonil-5-pirimidilo, 4-metanosulfonil-5-pirimidilo, 2-pirazinilo, 3-fluoro-2-pirazinilo, 5-fluoro-2-pirazinilo, 6-fluoro-2-pirazinilo, 3-cloro-2-pirazinilo, 5-cloro-2-pirazinilo, 6-cloro-2-pirazinilo, 3-bromo-2-pirazinilo, 5-bromo-2-pirazinilo, 6-bromo-2-pirazinilo, 3-metoxi-2-pirazinilo, 5-metoxi-2-pirazinilo, 6-metoxi-2-pirazinilo, 3-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 5-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 6-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 3-metil-2-pirazinilo, 5-metil-2-pirazinilo, 6-metil-2-pirazinilo, 3-trifluorometil-2-pirazinilo, 5-trifluorometil-2-pirazinilo, 6-trifluorometil-2-pirazinilo, 3-ciano-2-pirazinilo, 5-ciano-2-pirazinilo, 6-ciano-2-pirazinilo, 3-nitro-2-pirazinilo, 5-nitro-2-pirazinilo, 6-nitro-2-pirazinilo, 3-metilsulfonato-2-pirazinilo, 5-metilsulfonato-2-pirazinilo, o 6-metilsulfonato-2-pirazinilo;
- 35 y en el que:
- R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^2 son metilo, R^4 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es bromuro y R^3 es hidrógeno; o
- 40 R^1 es metilo, R^2 es cloruro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o
- R^1 es metilo, R^2 es bromuro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o
- R^1 y R^2 son metilo, R^4 es etenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es etinilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^2 son metilo, R^4 es etinilo, y R^3 es hidrógeno; o
- 45 R^1 y R^4 son metilo, R^2 es fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-fluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-cloro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 3-trifluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 4-fluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- 50 R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 4-cloro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o
- R^1 y R^4 son metilo, R^2 es 4-trifluoro-fenilo, y R^3 es hidrógeno; o

- R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 5 R¹ es etilo, R² y R⁴ son metilo y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es cloruro y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es cloruro y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es bromuro y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R² es cloruro, R³ es hidrógeno, y R⁴ es metoxi; o
 10 R¹ es etilo, R² es bromuro, R³ es hidrógeno, y R⁴ es metoxi; o
 R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ son metilo, R² es etinilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etinilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 15 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 20 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 25 R¹ y R⁴ es etilo, R² es metilo y R³ es hidrógeno.
12. Un compuesto según la reivindicación 1, el cual es un compuesto de tipo estructural T-1:



T-1

- en el que R⁵ es H,
 R⁶ y R⁷ son CH₃, y
 30 R⁸ y R⁹ son H; y

en el que HetAr es 2-piridilo, 3-fluoro-2-piridilo, 4-fluoro-2-piridilo, 5-fluoro-2-piridilo, 6-fluoro-2-piridilo, 3-cloro-2-piridilo, 4-cloro-2-piridilo, 5-cloro-2-piridilo, 6-cloro-2-piridilo, 3-metil-2-piridilo, 4-metil-2-piridilo, 5-metil-2-piridilo, 6-metil-2-piridilo, 3-trifluorometil-2-piridilo, 4-trifluorometil-2-piridilo, 5-trifluorometil-2-piridilo, 6-trifluorometil-2-piridilo, 3-metoxi-2-piridilo, 4-metoxi-2-piridilo, 5-metoxi-2-piridilo, 6-metoxi-2-piridilo, 3-trifluorometoxi-2-piridilo, 4-trifluorometoxi-2-piridilo, 5-trifluorometoxi-2-piridilo, 6-trifluorometoxi-2-piridilo, 3-ciano-2-piridilo, 4-ciano-2-piridilo, 5-ciano-2-piridilo, 6-ciano-2-piridilo, 3-nitro-2-piridilo, 4-nitro-2-piridilo, 5-nitro-2-piridilo, 6-nitro-2-piridilo, 3-metanosulfonil-2-piridilo, 4-metanosulfonil-2-piridilo, 5-metanosulfonil-2-piridilo, 6-metanosulfonil-2-piridilo, 3-piridilo, 2-fluoro-3-piridilo, 4-fluoro-3-piridilo, 5-fluoro-3-piridilo, 6-fluoro-3-piridilo, 2-cloro-3-piridilo, 4-cloro-3-piridilo, 5-cloro-3-piridilo, 6-cloro-3-piridilo, 2-bromo-3-piridilo, 4-bromo-3-piridilo, 5-bromo-3-piridilo, 6-bromo-3-piridilo, 2-metoxi-3-piridilo, 4-metoxi-3-piridilo, 5-metoxi-3-piridilo, 6-metoxi-3-piridilo, 2-trifluorometoxi-3-piridilo, 4-trifluorometoxi-3-piridilo, 5-trifluorometoxi-3-piridilo, 6-trifluorometoxi-3-piridilo, 2-metil-3-piridilo, 4-metil-3-piridilo, 5-metil-3-piridilo, 6-metil-3-piridilo, 2-trifluorometil-3-piridilo, 4-trifluorometil-3-piridilo, 5-trifluorometil-3-piridilo, 6-trifluorometil-3-piridilo, 2-ciano-3-piridilo, 4-ciano-3-piridilo, 5-ciano-3-piridilo, 6-ciano-3-piridilo, 2-nitro-3-piridilo, 4-nitro-3-piridilo, 5-nitro-3-piridilo, 6-nitro-3-piridilo, 2-metanosulfonil-3-piridilo, 4-metanosulfonil-3-piridilo, 5-metanosulfonil-3-piridilo, 6-metanosulfonil-3-piridilo, 4-piridilo, 2-fluoro-4-piridilo, 3-fluoro-4-piridilo, 2-cloro-4-piridilo, 3-cloro-4-piridilo, 2-bromo-4-piridilo, 3-bromo-4-piridilo, 2-metoxi-4-piridilo, 3-metoxi-4-piridilo, 2-trifluorometoxi-4-piridilo, 3-trifluorometoxi-4-piridilo, 2-metil-4-piridilo, 3-metil-4-piridilo, 2-trifluorometil-4-piridilo, 3-trifluorometil-4-piridilo, 2-ciano-4-piridilo, 3-ciano-4-piridilo, 2-nitro-4-piridilo, 3-nitro-4-piridilo, 2-metanosulfonil-4-piridilo, 3-metanosulfonil-4-piridilo, 2-piridazinilo, 4-fluoro-2-piridazinilo, 5-fluoro-2-piridazinilo, 6-fluoro-2-piridazinilo, 4-cloro-2-piridazinilo, 5-cloro-2-piridazinilo, 6-cloro-2-piridazinilo, 4-bromo-2-piridazinilo, 5-bromo-2-piridazinilo, 6-bromo-2-piridazinilo, 4-metoxi-2-piridazinilo, 5-metoxi-2-piridazinilo, 6-metoxi-2-piridazinilo, 4-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 5-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 6-trifluorometoxi-2-piridazinilo, 2-metil-2-piridazinilo, 4-metil-2-piridazinilo, 5-metil-2-piridazinilo, 6-metil-2-piridazinilo, 2-trifluorometil-3-piridazinilo, 4-trifluorometil-3-piridazinilo, 5-trifluorometil-3-piridazinilo, 6-trifluorometil-3-piridazinilo, 4-ciano-2-piridazinilo, 5-ciano-2-piridazinilo, 6-ciano-2-piridazinilo, 4-nitro-2-piridazinilo, 5-nitro-2-piridazinilo, 6-nitro-2-piridazinilo, 4-metanosulfonil-2-piridazinilo, 5-metanosulfonil-2-piridazinilo, 6-metanosulfonil-2-piridazinilo, 3-piridazinilo, 2-fluoro-3-piridazinilo, 5-fluoro-3-piridazinilo, 6-fluoro-3-piridazinilo, 2-cloro-3-piridazinilo, 5-cloro-3-piridazinilo, 6-cloro-3-piridazinilo, 2-bromo-3-piridazinilo, 5-bromo-3-piridazinilo, 6-bromo-3-piridazinilo, 2-metoxi-3-piridazinilo, 5-metoxi-3-piridazinilo, 6-metoxi-3-piridazinilo, 2-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 5-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 6-trifluorometoxi-3-piridazinilo, 2-metil-3-piridazinilo, 5-metil-3-piridazinilo, 6-metil-3-piridazinilo, 2-trifluorometil-3-piridazinilo, 5-trifluorometil-3-piridazinilo, 6-trifluorometil-3-piridazinilo, 2-ciano-3-piridazinilo, 5-ciano-3-piridazinilo, 6-ciano-3-piridazinilo, 2-nitro-3-piridazinilo, 5-nitro-3-piridazinilo, 6-nitro-3-piridazinilo, 2-metanosulfonil-3-piridazinilo, 5-metanosulfonil-3-piridazinilo, 6-metanosulfonil-3-piridazinilo, 2-pirimidilo, 4-fluoro-2-pirimidilo, 5-fluoro-2-pirimidilo, 4-cloro-2-pirimidilo, 5-cloro-2-pirimidilo, 4-bromo-2-pirimidilo, 5-bromo-2-pirimidilo, 4-metoxi-2-pirimidilo, 5-metoxi-2-pirimidilo, 4-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 5-trifluorometoxi-2-pirimidilo, 4-metil-2-pirimidilo, 5-metil-2-pirimidilo, 4-trifluorometil-2-pirimidilo, 5-trifluorometil-2-pirimidilo, 2-ciano-2-pirimidilo, 5-ciano-2-pirimidilo, 4-nitro-2-pirimidilo, 5-nitro-2-pirimidilo, 4-metanosulfonil-2-pirimidilo, 5-metanosulfonil-2-pirimidilo, 4-pirimidilo, 2-fluoro-4-pirimidilo, 5-fluoro-4-pirimidilo, 6-fluoro-4-pirimidilo, 2-cloro-4-pirimidilo, 5-cloro-4-pirimidilo, 6-cloro-4-pirimidilo, 2-bromo-4-pirimidilo, 5-bromo-4-pirimidilo, 6-bromo-4-pirimidilo, 2-metoxi-4-pirimidilo, 5-metoxi-4-pirimidilo, 6-metoxi-4-pirimidilo, 2-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 5-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 6-trifluorometoxi-4-pirimidilo, 2-metil-4-pirimidilo, 5-metil-4-pirimidilo, 6-metil-4-pirimidilo, 2-trifluorometil-4-pirimidilo, 5-trifluorometil-4-pirimidilo, 6-trifluorometil-4-pirimidilo, 2-ciano-4-pirimidilo, 5-ciano-4-pirimidilo, 6-ciano-4-pirimidilo, 2-nitro-4-pirimidilo, 5-nitro-4-pirimidilo, 6-nitro-4-pirimidilo, 2-metanosulfonil-4-pirimidilo, 5-metanosulfonil-4-pirimidilo, 6-metanosulfonil-4-pirimidilo, 5-pirimidilo, 2-fluoro-5-pirimidilo, 4-fluoro-5-pirimidilo, 2-cloro-5-pirimidilo, 4-cloro-5-pirimidilo, 2-bromo-5-pirimidilo, 4-bromo-5-pirimidilo, 2-metoxi-5-pirimidilo, 4-metoxi-5-pirimidilo, 2-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 4-trifluorometoxi-5-pirimidilo, 2-metil-5-pirimidilo, 4-metil-5-pirimidilo, 2-trifluorometil-5-pirimidilo, 4-trifluorometil-5-pirimidilo, 2-ciano-5-pirimidilo, 4-ciano-5-pirimidilo, 2-nitro-5-pirimidilo, 4-nitro-5-pirimidilo, 2-metanosulfonil-5-pirimidilo, 4-metanosulfonil-5-pirimidilo, 2-pirazinilo, 3-fluoro-2-pirazinilo, 5-fluoro-2-pirazinilo, 6-fluoro-2-pirazinilo, 3-cloro-2-pirazinilo, 5-cloro-2-pirazinilo, 6-cloro-2-pirazinilo, 3-bromo-2-pirazinilo, 5-bromo-2-pirazinilo, 6-bromo-2-pirazinilo, 3-metoxi-2-pirazinilo, 5-metoxi-2-pirazinilo, 6-metoxi-2-pirazinilo, 3-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 5-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 6-trifluorometoxi-2-pirazinilo, 3-metil-2-pirazinilo, 5-metil-2-pirazinilo, 6-metil-2-pirazinilo, 3-trifluorometil-2-pirazinilo, 5-trifluorometil-2-pirazinilo, 6-trifluorometil-2-pirazinilo, 3-ciano-2-pirazinilo, 5-ciano-2-pirazinilo, 6-ciano-2-pirazinilo, 3-nitro-2-pirazinilo, 5-nitro-2-pirazinilo, 6-nitro-2-pirazinilo, 3-metilsulfonato-2-pirazinilo, 5-metilsulfonato-2-pirazinilo, o 6-metilsulfonato-2-pirazinilo;

y en el que:

R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno; o

55 R^1 y R^4 son metilo, R^2 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o

R^1 y R^2 son metilo, R^4 es cloruro y R^3 es hidrógeno; o

R^1 y R^4 son metilo, R^2 es bromuro y R^3 es hidrógeno; o

R^1 es metilo, R^2 es cloruro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o

R^1 es metilo, R^2 es bromuro, R^3 es hidrógeno, y R^4 es metoxi; o

- R¹ y R² son metilo, R⁴ es etenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es etinilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R² son metilo, R⁴ es etinilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es fenilo, y R³ es hidrógeno; o
- 5 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
- 10 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 4-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ y R⁴ son metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
- 15 R¹ es etilo, R² y R⁴ son metilo y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es cloruro y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es cloruro y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es bromuro y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R² es cloruro, R³ es hidrógeno, y R⁴ es metoxi; o
- 20 R¹ es etilo, R² es bromuro, R³ es hidrógeno, y R⁴ es metoxi; o
 R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ son metilo, R² es etinilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R² es metilo, R⁴ es etinilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es fenilo, y R³ es hidrógeno; o
- 25 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
- 30 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 4-trifluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-difluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-fluoro-4-cloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3-cloro-4-fluoro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
 R¹ es etilo, R⁴ es metilo, R² es 3,4-dicloro-fenilo, y R³ es hidrógeno; o
- 35 R¹ y R⁴ es etilo, R² es metilo y R³ es hidrógeno.

13. Una composición herbicida, que, además de comprender auxiliares de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8.

14. Una composición herbicida según la reivindicación 13, que, además de comprender auxiliares de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz del compuesto de fórmula I, un herbicida adicional, y opcionalmente un protector.
- 5 15. Una composición herbicida según la reivindicación 13, que, además de comprender auxiliares de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz del compuesto de fórmula I, un protector, y opcionalmente un herbicida adicional.
16. Un método para controlar hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, o de una composición que comprende tal compuesto, a las plantas o a su locus.
- 10 17. Un método según la reivindicación 16, que es un método para controlar hierbas y malas hierbas en cultivo de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente eficaz de una composición que comprende el compuesto de fórmula I a las plantas o a su locus, y en el que
- los cultivos de plantas útiles son trigo, cebada, arroz, maíz, colza, remolacha, caña de azúcar, haba de soja, algodón, girasol, o cacahuete.
- 15 18. Un método según la reivindicación 17, en el que los cultivos de plantas útiles son trigo o cebada.
19. Una mezcla de un compuesto de fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en combinación con un herbicida adicional, en el que la mezcla del compuesto de fórmula I se selecciona de:
- compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfen-sodio, compuesto de fórmula I + aclonifen, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopirralida, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de fórmula I + anilofós, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benazolina, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzfendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafós, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + bórax, compuesto de fórmula I + bromacilo, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + butamifós, compuesto de fórmula I + butralina, compuesto de fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + clorflurenol, compuesto de fórmula I + clorflurenol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + clorimurón, compuesto de fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + clortal, compuesto de fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + orto-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + para-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclorprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenican, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrin, compuesto de fórmula I + dimetenamid, compuesto de fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de fórmula I + dimetipin, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarsínico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamid,
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40
- 45
- 50
- 55
- 60

compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diurón, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfuralin, compuesto de fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifeno, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula I + etobenzanida, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop-P, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloralin, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofeno, compuesto de fórmula I + fluoroglicofen-etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metilo-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula I + fomesafeno, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amónico, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula I + HC-252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquin, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofan, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + yoxinilo, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + isourón, compuesto de fórmula I + isoxaben, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofeno, compuesto de fórmula I + lenacilo, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metabenziazurón, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S-metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalina, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazona, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfenol, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamida, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + piperofós, compuesto de fórmula I + arsenito potásico, compuesto de fórmula I + azida potásica, compuesto de fórmula I + pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluzol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraclonilo, compuesto de fórmula I + piraflufeno, compuesto de fórmula I + piraflufeno-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifeno, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I +

5 piriftalida, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfan, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quinclorac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quinoclamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito de sodio, compuesto de fórmula I + azida sódica, compuesto de fórmula I + clorato de sodio, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio, compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacilo, compuesto de fórmula I + terbumetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de fórmula I + topamezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + tri-alato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético, compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofen-3-carboxílico, compuesto de fórmula I + BAY747 que tiene el número de referencia de Chemical Abstracts Service 335104-84-2, compuesto de fórmula I + topamezona, compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (, y compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona;

20
 25
 30 y en el que la pareja de mezclamiento para el compuesto de fórmula I está opcionalmente en forma de un éster o una sal.