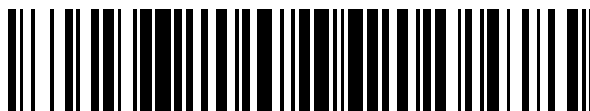


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 588 602**

51 Int. Cl.:

**C07D 241/52** (2006.01)  
**A01N 43/42** (2006.01)  
**A01N 43/60** (2006.01)  
**A01N 43/90** (2006.01)  
**A01P 3/00** (2006.01)  
**C07D 401/12** (2006.01)  
**C07D 471/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **17.05.2012 PCT/JP2012/062618**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **29.11.2012 WO12161071**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **17.05.2012 E 12790304 (5)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **29.06.2016 EP 2711361**

54 Título: **Compuesto heterocíclico nitrogenado y fungicida agrícola u hortícola**

30 Prioridad:

**20.05.2011 JP 2011113174**  
**28.06.2011 JP 2011143478**  
**21.11.2011 JP 2011254368**  
**15.12.2011 JP 2011274141**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**03.11.2016**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**SHIBAYAMA KOTARO;**  
**KUWAHARA RAITO;**  
**SATO MOTOAKI;**  
**NISHIMURA SATOSHI;**  
**SHIINOKI YASUYUKI;**  
**YOKOYAMA MASAHIRO y**  
**KITAMURA JURI**

74 Agente/Representante:

**CURELL AGUILÁ, Mireia**

ES 2 588 602 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

Compuesto heterocíclico nitrogenado y fungicida agrícola u hortícola.

5 **Campo técnico**

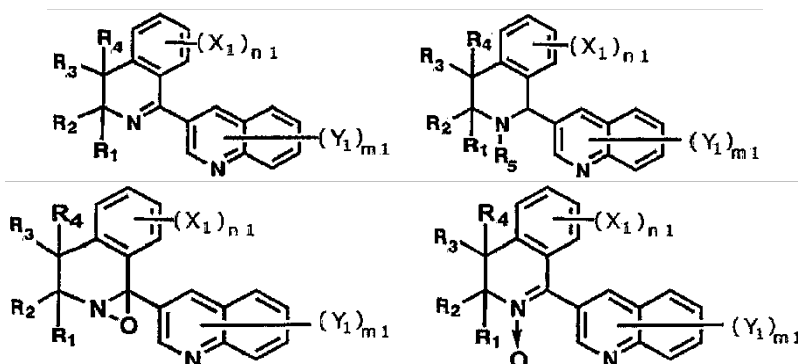
La presente invención se refiere a un fungicida agrícola u hortícola que demuestra efectos fiables y que se puede usar de forma segura, y a un compuesto heterocíclico nitrogenado que es útil como principio activo de un fungicida agrícola u hortícola.

10 La presente solicitud reivindica la prioridad en la solicitud de patente japonesa nº 2011-113174 presentada en Japón el 20 de mayo de 2011, solicitud de patente japonesa nº 2011-143478 presentada en Japón el 28 de junio de 2011, solicitud de patente japonesa nº 2011-254368 presentada en Japón el 21 de noviembre de 2011, y solicitud de patente japonesa nº 2011-274141 presentada en Japón el 15 de diciembre de 2011.

15 **Antecedentes de la técnica**

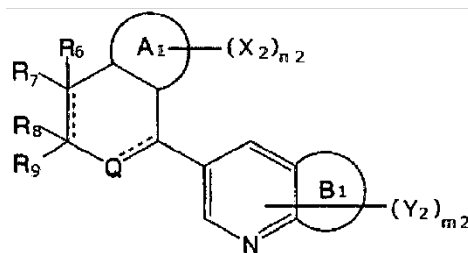
Se han usado numerosos agentes de control frente a enfermedades de cultivos agrícolas u hortícolas. Sin embargo, puesto que los efectos de control de muchos agentes de control son inadecuados, su uso se ha limitado por razones de la aparición de patógenos resistentes a fármacos, daño químico o contaminación de las plantas, toxicidad a seres humanos, ganado y peces, o efectos significativos sobre el medio ambiente, y ninguno de estos agentes de control ha sido suficientemente satisfactorio. En consecuencia, existe un fuerte deseo de desarrollar un fármaco que tenga pocas de estas limitaciones.

25 En relación con la presente invención, el documento 1 de patente describe compuestos de 3-(dihidro(tetrahydro)isoquinolin-1-il)quinolina representados mediante las siguientes fórmulas:



30 (en las que  $R_1$  y  $R_2$  representan grupos alquilo o similares,  $R_3$  y  $R_4$  representan átomos de hidrógeno, átomos de halógeno, o similares,  $R_5$  representa un átomo de hidrógeno, grupo alquilo, o similar,  $X_1$  representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo, o similar,  $Y_1$  representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo, o similar,  $n$  representa un número entero de 0 a 4, y  $m$  representa un número entero de 0 a 6), y un herbicida que tiene estos compuestos como un principio activo del mismo.

35 Adicionalmente, el documento 2 de patente describe un compuesto de 3-(isoquinolin-1-il)quinolina representado mediante la siguiente fórmula:

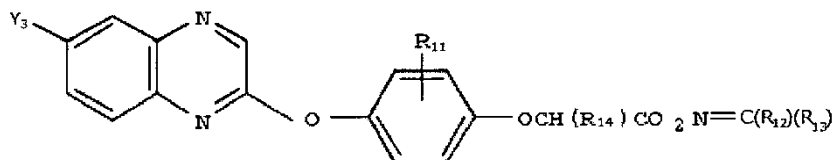


40 (en la que el anillo  $A_1$  y el anillo  $B_1$  representan anillos de benceno o similares,  $R_6$  a  $R_9$  representan átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos hidroxilo, grupos alcoxi, o similares,  $Q$  representa N o N- $R_{10}$  (en el que  $R_{10}$  representa un átomo de hidrógeno, grupo hidroxilo, grupo alquilo, o similar),  $X_2$  representa un átomo de halógeno, grupo alquilo, o similar,  $Y_2$  representa un átomo de halógeno, grupo alquilo, o similar,  $n_2$  representa un número entero de 0 a 4,  $m_2$  representa un número entero de 0 a 6, y los enlaces que contienen líneas discontinuas representan enlaces sencillos o enlaces dobles), y un insecticida que tiene ese compuesto como principio activo del

mismo.

Además, el documento 3 de patente describe un derivado de éster del ácido fenoxipropiónico representado mediante la siguiente fórmula:

5

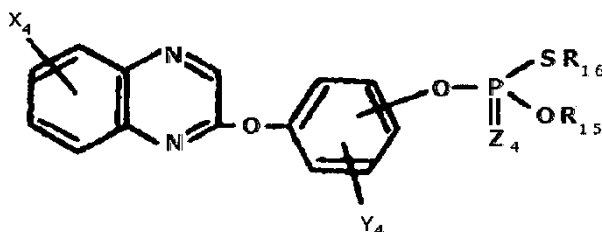


10

(en la que Y<sub>3</sub> representa un átomo de halógeno, R<sub>11</sub>, R<sub>12</sub> y R<sub>13</sub> representan, respectiva e independientemente, un grupo alquilo inferior o un grupo alcoxi inferior, y R<sub>14</sub> representa un grupo alquilo inferior), y un herbicida que tiene ese compuesto como principio activo del mismo.

Adicionalmente, el documento 4 de patente describe un compuesto de quinoxalina representado mediante la siguiente fórmula:

15

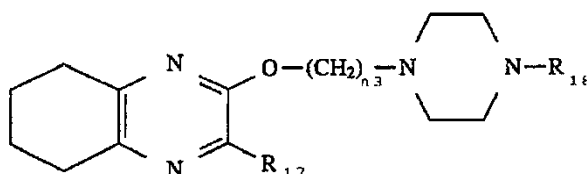


20

(en la que X<sub>4</sub> representa un átomo de hidrógeno, átomo de halógeno, o similar, Y<sub>4</sub> representa un átomo de halógeno o grupo alquilo, Z<sub>4</sub> representa un átomo de oxígeno o átomo de azufre, y R<sub>15</sub> y R<sub>16</sub> representan grupos alquilo), y un insecticida que tiene ese compuesto como principio activo del mismo.

Adicionalmente, el documento 5 de patente describe una composición farmacéutica que contiene un compuesto representado mediante la siguiente fórmula:

25



(en la que R<sub>17</sub> representa un átomo de hidrógeno, grupo alquilo, o similar, R<sub>18</sub> representa un grupo piridilo, grupo arilo, o similar, y n<sub>3</sub> representa un número entero de 2 a 5).

30

El documento WO 2011/081174 es un documento de técnica anterior según el Artículo 54(3) EPC, y describe compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno, en los que los derivados quinolínicos están sustituidos con un grupo fenoxi.

#### Documentos de la técnica anterior

#### 35 Documentos de patentes

Documento 1 de patente: Publicación internacional nº WO 2005/070917

Documento 2 de patente: Publicación internacional nº WO 2007/011022

40

Documento 3 de patente: Solicitud de patente japonesa sin examinar, primera publicación nº H05-148235

Documento 4 de patente: Solicitud de patente japonesa sin examinar, primera publicación nº S58-92690

45

Documento 5 de patente: Patente U.S. nº 5.578.596

Se puede hacer referencia adicional al documento JP05032639.

**Documentos no de patentes**

Documento 1 No de patente: Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol. 24, (1), p. 93-101

**5 Descripción de la invención**

Problemas que debe resolver por la invención

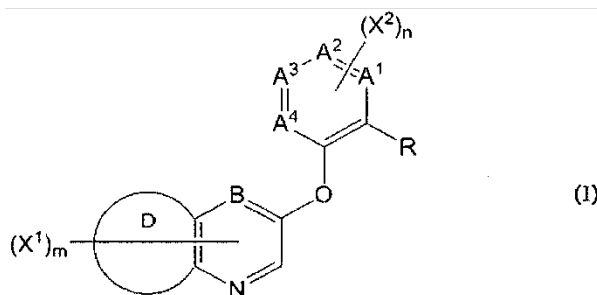
10 Un objetivo de la presente invención es proporcionar un fungicida agrícola u hortícola que demuestra efectos fiables y que se puede usar de forma segura, y un compuesto heterocíclico nitrogenado, o una sal del mismo, que es útil como un principio activo de un fungicida agrícola u hortícola.

Medios para resolver los problemas

15 Los inventores de la presente invención realizaron unos estudios exhaustivos para resolver los problemas mencionados anteriormente. Los resultados de los mismos condujeron a la obtención de un compuesto heterocíclico nitrogenado representado por la fórmula (I) y sus sales. Los inventores de la presente invención encontraron que este compuesto heterocíclico nitrogenado demuestra efectos fiables y se puede usar de forma segura como principio activo de un fungicida agrícola u hortícola. Entonces se llevaron a cabo adicionalmente otros estudios sobre la base de estos hallazgos, conduciendo de ese modo a la terminación de la presente invención.

Principalmente, la presente descripción incluye los aspectos descritos a continuación.

25 [1] Un compuesto heterocíclico nitrogenado representado mediante la fórmula (I), o una sal del mismo:



(en la que

30 R representa un grupo representado por  $CR^1R^2R^3$  o un grupo ciano;

35  $R^1$  a  $R^3$  representan, respectiva e independientemente, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueno de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquino de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalqueno de C4-8 no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo no sustituido o sustituido, un grupo carbamoilo no sustituido o sustituido, un grupo amina no sustituido o sustituido, un grupo mercapto no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro,

40 con la condición de que  $R^1$  a  $R^3$  no sean todos átomos de hidrógeno,  $R^1$  a  $R^3$  no sean todos grupos alquilo de C1-8 no sustituidos; en el caso de que uno cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  sea un átomo de hidrógeno, los otros dos no son grupos alquilo de C1-8 no sustituidos; en el caso de que uno cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  sea un grupo alquilo de C1-8 no sustituido, los otros dos no son átomos de hidrógeno, y  $R^1$  a  $R^3$  pueden formar juntos un anillo de 5 a 8 miembros no sustituido o sustituido, o pueden formar un grupo representado por =O, un grupo representado por  $=CR^aR^b$  (en el que  $R^a$  y  $R^b$  representan, respectiva e independientemente, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido), o un grupo representado por =N-R' (en el que R' representa un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido o un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido);

50  $X^1$  representa, respectiva e independientemente, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueno de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquino de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

55 m representa el número de  $X^1$  y es un número entero de 0 a 5;

$X^2$  representa, respectiva e independientemente, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquenilo de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquenilo de C4-8 no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo no sustituido o sustituido, un grupo carbamóilo no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo mercapto no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

$n$  representa el número de  $X^2$  y es un número entero de 0 a 3;

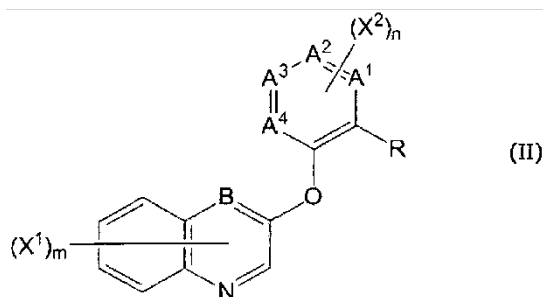
uno cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  y uno cualquiera de  $X^2$  pueden formar juntos un anillo de 5 a 8 miembros no sustituido o sustituido;

$B$  representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno;

$D$  representa un anillo hidrocarbonado de 5 a 7 miembros no sustituido o sustituido con  $X^1$ , o un heterociclo de 5 a 7 miembros no sustituido o sustituido con  $X^1$ ; y

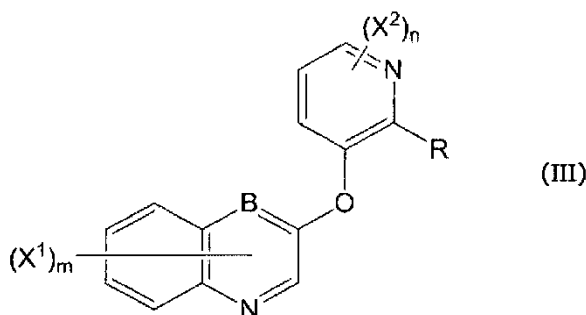
$A^1$ ,  $A^2$ ,  $A^3$  y  $A^4$  representan, respectiva e independientemente, un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno, con la condición de que en el caso de que  $B$  sea un átomo de carbono,  $A^1$  a  $A^4$  no sean todos átomos de carbono.

[2] Un compuesto heterocíclico nitrogenado, o sal del mismo, en el que la fórmula (I) descrita en [1] anterior se representa mediante la fórmula (II):



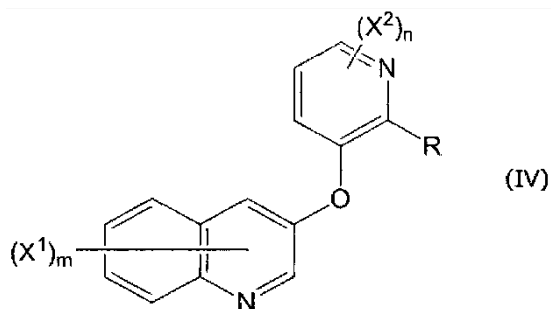
(en la que,  $R$ ,  $X^1$ ,  $m$ ,  $X^2$ ,  $n$ ,  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $A^3$ ,  $A^4$  y  $B$  tienen respectivamente los mismos significados que aquellos en la fórmula (I) descrita en [1] anterior).

[3] Un compuesto heterocíclico nitrogenado, o sal del mismo, en el que la fórmula (I) descrita en [1] anterior se representa mediante la fórmula (III).



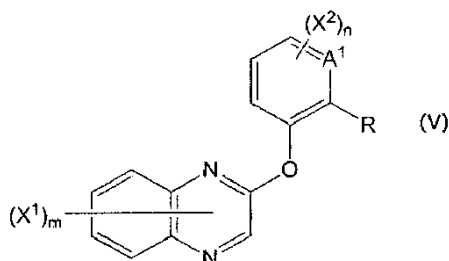
En la fórmula (III),  $R$ ,  $X^1$ ,  $m$ ,  $X^2$ ,  $n$  y  $B$  tienen respectivamente los mismos significados que aquellos en la fórmula (I) descrita en [1] anterior.

[4] Un compuesto heterocíclico nitrogenado, o sal del mismo, en el que la fórmula (I) descrita en [1] anterior se representa mediante la fórmula (IV):



(en la fórmula (IV), R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup> y n tienen respectivamente los mismos significados que aquellos en la fórmula (I) descrita en [1] anterior).

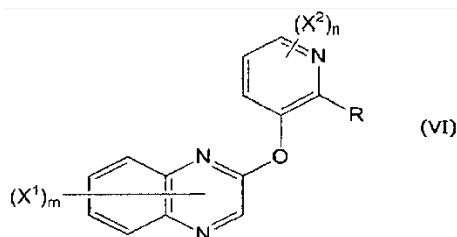
5 [5] Un compuesto heterocíclico nitrogenado, o sal del mismo, en el que la fórmula (I) descrita en [1] anterior se representa mediante la fórmula (V):



(en la fórmula (V), R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n y A<sup>1</sup> tienen respectivamente los mismos significados que aquellos en la fórmula (I) descrita en [1] anterior).

La presente invención incluye los aspectos descritos a continuación.

15 [6] Un compuesto heterocíclico nitrogenado, o sal del mismo, en el que la fórmula (I) descrita en [1] anterior se representa mediante la fórmula (VI):



(en la fórmula (VI), R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup> y n tienen respectivamente los significados como en la reivindicación 1.

25 [7] Un fungicida agrícola u hortícola que tiene como principio activo del mismo al menos un tipo de compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos heterocíclicos nitrogenados y sales de los mismos descritos en [6] anterior.

### Efectos de la invención

30 El compuesto heterocíclico nitrogenado de la presente invención es un compuesto nuevo que es útil como principio activo de un fungicida agrícola u hortícola.

El fungicida agrícola u hortícola de la presente invención es un agente químico seguro que tiene efectos de control fiables y excelentes, no provoca daño químico a las plantas, y tiene poca toxicidad para seres humanos, ganado o peces, y tiene poco efecto sobre el medio ambiente.

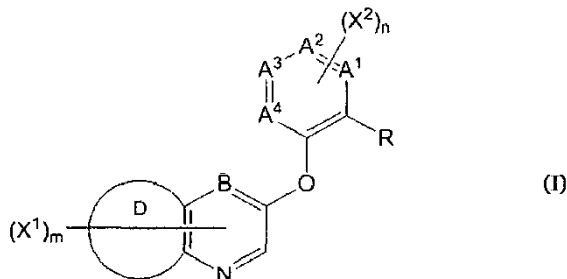
### Formas de realización de la invención

40 A continuación se proporciona una descripción detallada de la presente invención al dividirla en secciones en 1) el compuesto heterocíclico nitrogenado, y 2) el fungicida agrícola u hortícola.

## 1) Compuesto heterocíclico nitrogenado

Un compuesto heterocíclico nitrogenado según la presente descripción es un compuesto representado por la fórmula (I) (también indicado como "Compuesto (I)").

5



El compuesto heterocíclico nitrogenado según la presente descripción incluye hidratos, diversos tipos de solvatos, polimorfos cristalinos, o similares. Además, el compuesto heterocíclico nitrogenado según la presente invención incluye estereoisómeros basados en un átomo de carbono asimétrico o doble enlace y similar, así como mezclas de los mismos.

10

En primer lugar, se proporciona una explicación de los significados de "no sustituido" y "sustituido" en la fórmula (I).

15

El término "no sustituido" se refiere a que el grupo es el único grupo que sirve como núcleo madre. Cuando no existe ninguna descripción de estar "sustituido" y solamente se proporciona una descripción para el nombre del grupo que sirve como núcleo madre, ésta se refiere a "no sustituido" excepto que se indique específicamente de otro modo.

20

Por otro lado, el término "sustituido" se refiere a cualquier átomo de hidrógeno de un grupo que sirve como un núcleo madre que está sustituido por un grupo que tiene una estructura que es la misma que o diferente del núcleo madre. De este modo, un "sustituyente" es otro grupo unido a un grupo que sirve como el núcleo madre. Puede haber un sustituyente o dos o más sustituyentes. Dos o más sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

25

El término "C1-6", por ejemplo, indica que el número de átomos de carbono del grupo que sirve como el núcleo madre es 1 a 6. Este número de átomos de carbono no incluye el número de átomos de carbono presentes en los sustituyentes. Por ejemplo, un grupo butilo que tiene un grupo etoxi como sustituyente del mismo se clasifica como un grupo alcoxi de C2 alquilo de C4.

30

No existen limitaciones particulares sobre los "sustituyentes" con la condición de que estén químicamente permitidos y que tengan el efecto de la presente descripción.

35

Los ejemplos de grupos aptos para ser "sustituyentes" incluyen átomos de halógeno tales como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo; grupos alquilo de C1-6 tales como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, o un grupo n-hexilo; grupos cicloalquilo de C3-6 tales como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo o un grupo ciclohexilo; grupos alqueno de C2-6 tales como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo o un grupo 5-hexenilo; grupos cicloalqueno de C3-6 tales como un grupo 2-ciclopropenilo, un grupo 2-ciclopentenilo o un grupo 3-ciclohexenilo; grupos alquino de C2-6 tales como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo o un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo;

45

grupos alcoxi de C1-6 tales como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; grupos alqueno C2-6-oxi tales como un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi o un grupo buteniloxi; grupos alquino C2-6-oxi tales como un grupo etiniloxi o un grupo propargiloxi; grupos arilo de C6-10 tales como un grupo fenilo o un grupo naftilo; grupos ariloxi de C6-10 tales como un grupo fenoxi o un grupo 1-naftoxi; grupos aralquilo de C7-11 tales como un grupo bencilo o un grupo fenetilo; grupos aralquilo C7-11-oxi tales como un grupo benciloxi o un grupo fenetiloxi; grupos acilo de C1-7 tales como un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzóilo o un grupo ciclohexilcarbonilo; grupos acil C1-7-oxi tales como un grupo formiloxi, un grupo acetiloxi, un grupo propioniloxi, un grupo benzoiloxi o un grupo ciclohexilcarboniloxi; grupos alcoxi C1-6-carbonilo tales como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo o un grupo t-butoxicarbonilo; un grupo carboxilo;

50

55

un grupo hidroxilo; un grupo oxo; grupos haloalquilo de C1-6 tales como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo o un grupo perfluoro-n-pentilo; grupos haloalqueno de C2-6 tales como un grupo 2-cloro-1-propeno o un grupo 2-fluoro-1-butenilo; grupos haloalquino de C2-6 tales como un grupo 4,4-dicloro-1-butileno, un grupo 4-fluoro-1-penteno o un grupo 5-bromo-2-penteno; grupos haloalcoxi de C1-6 tales como un grupo 2-cloro-n-propoxi o un grupo 2,3-diclorobutoxi; grupos haloalquenoil C2-6-oxi tales como un grupo 2-cloropropenoiloxi o un grupo 3-bromobuteniloxi; grupos haloarilo de C6-10 tales como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo o un grupo 2,4-diclorofenilo; grupos haloaril C6-10-oxi tales como un grupo 4-fluorofeniloxi o un grupo 4-cloro-1-naftoxi; grupos haloacilo de C1-7 tales como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo o un grupo 4-clorobenzoilo;

un grupo ciano; un grupo isociano; un grupo nitro; un grupo isocianato; un grupo cianato; un grupo azida; un grupo amino; grupos alquil C1-6-amino tales como un grupo metilamino, un grupo dimetilamino o un grupo dietilamino; grupos aril C6-10-amino tales como un grupo anilino o un grupo naphtilamino; grupos aralquil C7-11-amino tales como un grupo bencilamino o un grupo feniletilamino; grupos acil C1-7-amino tales como un grupo formilamino, un grupo acetilamino, un grupo propanoilamino, un grupo butirilamino, un grupo i-propilcarbonilamino o un grupo benzoilamino; grupos alcoxi C1-6-carbonilamino tales como un grupo metoxicarbonilamino, un grupo etoxicarbonilamino, un grupo n-propoxicarbonilamino o un grupo i-propoxicarbonilamino; un grupo carbamoilo; un grupo carbamoilo sustituido tal como un grupo dimetilcarbamoilo, un grupo fenilcarbamoilo o un grupo N-fenil-N-metilcarbamoilo; grupos iminoalquilo de C1-6 tales como un grupo iminometilo, un grupo (1-imino)etilo o un grupo (1-imino)-n-propilo; grupos hidroxiiiminoalquilo de C1-6 tales como un grupo hidroxiiiminometilo, un grupo (1-hidroxiiimino)etilo o un grupo (1-hidroxiiimino)propilo; grupos alcoxi C1-6-imino-alquilo de C1-6 tales como un grupo metoxiiiminometilo o un grupo (1-metoxiiimino)etilo;

un grupo mercapto; un grupo isotiocianato; un grupo tiocianato; grupos alquil C1-6-tio tales como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo i-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo i-butiltio, un grupo s-butiltio o un grupo t-butiltio; grupos alquenoil C2-6-tio tales como un grupo viniltio o un grupo aliltio; grupos alquinoil C2-6-tio tales como un grupo etiniltio o un grupo propargiltio; grupos aril C6-10-tio tales como un grupo feniltio o un grupo naftiltio; grupos heteroariltio tales como un grupo tiazoliltio o un grupo piridiltio; grupos aralquil C7-11-tio tales como un grupo benciltio o un grupo feniltio; grupos (alquil C1-6-tio)carbonilo tales como un grupo (metiltio)carbonilo, un grupo (etiniltio)carbonilo, un grupo (n-propiltio)carbonilo, un grupo (i-propiltio)carbonilo, un grupo (n-butiltio)carbonilo, un grupo (i-butiltio)carbonilo, un grupo (s-butiltio)carbonilo o un grupo (t-butiltio)carbonilo;

grupos alquil C1-6-sulfino tales como un grupo metilsulfino, un grupo etilsulfino o un grupo t-butilsulfino; grupos alquenoil C2-6-sulfino tales como un grupo alilsulfino; grupos alquinoil C2-6-sulfino tales como un grupo propargilsulfino; grupos aril C6-10-sulfino tales como un grupo fenilsulfino; grupos heteroarilsulfino tales como un grupo tiazolilsulfino o un grupo piridilsulfino; grupos aralquil C7-11-sulfino tales como un grupo bencilsulfino o un grupo fenilsulfino; grupos alquil C1-6-sulfonilo tales como un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo o un grupo t-butilsulfonilo; grupos alquenoil C2-6-sulfonilo tales como un grupo alilsulfonilo; grupos alquinoil C2-6-sulfonilo tales como un grupo propargilsulfonilo; grupos aril C6-10-sulfonilo tales como un grupo fenilsulfonilo; grupos heteroarilsulfonilo tales como un grupo tiazolilsulfonilo o un grupo piridilsulfonilo; grupos aralquil C7-11-sulfonilo tales como un grupo bencilsulfonilo o un grupo fenilsulfonilo;

grupos heteroarilo de 5 miembros tales como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo o un grupo tetrazolilo; grupos heteroarilo de 6 miembros tales como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; grupos heterocíclicos saturados tales como un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofurano, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo o un grupo morfolinilo; grupos tri-alquil C1-6-sililo tales como un grupo trimetilsililo, un grupo trietilsililo o un grupo t-butildimetilsililo; y, un grupo trifenilsililo.

Además, estos "sustituyentes" también pueden tener otros "sustituyentes" en ellos. Por ejemplo, un sustituyente puede ser el que presente un grupo etoxi como otro sustituyente en un sustituyente en forma de un grupo butilo, o en otras palabras, un grupo etoxibutilo.

[R]

R representa un grupo representado por  $CR^1R^2R^3$  o un grupo ciano.

$R^1$  a  $R^3$  representan, respectiva e independientemente, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquenoil de C4-8 no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo no sustituido o sustituido, un grupo carbamoilo no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo mercapto no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilo



sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro,

con la condición de que  $R^1$  a  $R^3$  no sean todos átomos de hidrógeno,  $R^1$  a  $R^3$  no sean todos grupos alquilo de C1-8 no sustituidos; en el caso de que uno cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  sea un átomo de hidrógeno, los otros dos no sean grupos alquilo de C1-8 no sustituidos; y en el caso de que uno cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  sea un grupo alquilo de C1-8 no sustituido, los otros dos no sean átomos de hidrógeno.

Un "grupo alquilo de C1-8" es un grupo hidrocarbonado saturado compuesto de 1 a 8 átomos de carbono. El grupo alquilo de C1-8 puede ser lineal o ramificado. Ejemplos de grupos alquilo de C1-8 incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo n-heptilo, un grupo n-octilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo 2,2-dimetilpropilo y un grupo i-hexilo. Entre estos, se prefieren grupos alquilo de C1-6.

Ejemplos de "grupos alquilo de C1-8 sustituidos" incluyen:

grupos cicloalquilalquilo tales como un grupo ciclopropilmetilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo ciclopentilmetilo o un grupo 2-ciclohexiletilo, y preferiblemente grupos cicloalquil C3-6-alquilo de C1-8;

grupos cicloalquenilalquilo tales como un grupo ciclopentenilmetilo, un grupo 3-ciclopentenilmetilo, un grupo 3-ciclohexenilmetilo un grupo 2-(3-ciclohexenil)etilo, y preferiblemente grupos cicloalqueniil C4-6-alquilo de C1-6;

grupos haloalquilo tales como un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletilo, un grupo perfluorohexilo, un grupo perclorohexilo, un grupo perfluorooctilo, un grupo perclorooctilo, un grupo 2,4,6-triclorohexilo, un grupo perfluorodecilo, un grupo 2,2,4,4,6,6-hexafluorooctilo, y preferentemente grupos haloalquilo de C1-6;

grupos arilalquilo (aralquilo) tales como un grupo bencilo, un grupo fenetilo, un grupo 3-fenilpropilo, un grupo 1-naftilmetilo o un grupo 2-naftilmetilo, y preferiblemente grupos aril C6-10-alquilo de C1-6;

grupos heteroarilalquilo tales como un grupo 2-piridilmetilo, un grupo 3-piridilmetilo, un grupo 4-piridilmetilo, un grupo 2-(2-piridil)etilo, un grupo 2-(3-piridil)etilo, un grupo 2-(4-piridil)etilo, un grupo 3-(2-piridil)propilo, un grupo 3-(3-piridil)propilo, un grupo 3-(4-piridil)propilo, un grupo 2-piridinilmetilo, un grupo 3-pirazinilmetilo, un grupo 2-(2-pirazinil)etilo, un grupo 2-(3-pirazinil)etilo, un grupo 3-(2-pirazinil)propilo, un grupo 3-(3-pirazinil)propilo, un grupo 2-pirimidilmetilo, un grupo 4-pirimidilmetilo, un grupo 2-(2-pirimidil)etilo, un grupo 2-(4-pirimidil)etilo, un grupo 3-(2-pirimidil)propilo, un grupo 3-(4-pirimidil)propilo, un grupo 2-furilmetilo, un grupo 3-furilmetilo, un grupo 2-(2-furil)etilo, un grupo 2-(3-furil)etilo, un grupo 3-(2-furil)propilo, un grupo 3-(3-furil)propilo, y preferentemente grupos heteroaril de 5 a 6 miembros-alquilo de C1-6;

grupos hidroxialquilo tales como un grupo hidroximetilo, un grupo 1-hidroxietilo, un grupo 2-hidroxietilo, un grupo 1-hidroxipropilo, un grupo 3-hidroxipropilo, un grupo 1-hidroxi-1-metiletilo, un grupo 2-hidroxi-1,1-dimetiletilo, un grupo 2-hidroxi-1,1-dimetilpropilo o un grupo 2-hidroxi-2-metilpropilo, y preferentemente grupos hidroxilo-alquilo de C1-6;

grupos alcoxialquilo tales como un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo metoxi-n-propilo, un grupo n-propoximetilo, un grupo i-propoxietilo, un grupo s-butoximetilo, un grupo t-butoxietilo, un grupo 2,2-dimetoxietilo, un grupo 2,2-dimetoxi-1,1-dimetiletilo, y preferentemente grupos alcoxi C1-6-alquilo de C1-6;

grupos acioxialquilo tales como un grupo formiloximetilo, un grupo acetoximetilo, un grupo 2-acetoxietilo, un grupo propioniloximetilo, un grupo propioniloxietilo, y preferentemente grupos acil C1-7-oxi-alquilo de C1-6;

grupos trialquilsililoxialquilo tales como un grupo trimetilsililoximetilo, un grupo t-butildimetilsililoximetilo, y preferentemente grupos tri-alquil C1-6-sililoxi-alquilo de C1-6;

grupos arilsulfoniloxialquilo tales como un grupo tosioximetilo, un grupo 2-tosiloxi-1,1-dimetiletilo, y preferentemente grupos aril C6-10 sustituido con alquilo de C1-6-sulfoniloxi-alquilo de C1-6;

grupos cianoalquilo tales como un grupo cianometilo, un grupo 2-cianoetilo, un grupo 1-ciano-1-metiletilo, y preferentemente grupos ciano-alquilo de C1-6;

grupos acilalquilo tales como un grupo formilmetilo, un grupo 2-formiletilo, un grupo 3-formilpropilo, un grupo 1-formil-1-metiletilo, un grupo 2-formil-1,1-dimetiletilo, un grupo acetilmetilo, un grupo 2-acetiletilo, un grupo

3-acetilpropilo, un grupo 1-acetil-1-metiletilo, un grupo 2-acetil-1,1-dimetiletilo, y preferentemente grupos acil C1-7-alquilo de C1-6;

5 grupos 2-hidroxiiminoalquilo tales como un grupo 2-hidroxiiminoetilo, un grupo 2-hidroxiimino-1-metiletilo, un grupo 2-hidroxi-1,1-dimetiletilo, un grupo 2-hidroxiiminopropilo, y preferentemente grupos 2-hidroxiimino-alquilo de C2-6;

10 grupos acilalquilo tales como un grupo acetilmetilo, un grupo 2-acetiletilo, un grupo 3-acetilpropilo, un grupo 1-acetil-1-metiletilo, un grupo 2-acetil-1,1-dimetiletilo, y preferiblemente grupos acil C1-7-alquilo de C1-6;

grupos carboxialquilo tales como un grupo carboximetilo, un grupo 2-carboxietilo, un grupo 3-carboxipropilo, un grupo 1-carboxi-1-metiletilo, un grupo 2-carboxi-1,1-dimetiletilo, y preferentemente grupos carboxialquilo de C1-6;

15 grupos alcoxicarbonilalquilo tales como un grupo metoxicarbonilmetilo, un grupo 2-metoxicarboniletilo, un grupo 3-metoxicarbonilpropilo, un grupo 1-metoxicarbonil-1-metiletilo, un grupo 2-metoxicarbonil-1,1-dimetiletilo, y preferentemente grupos alcoxi C1-6-carbonil-alquilo de C1-6; y

20 grupos azidoalquilo tales como un grupo azidometilo, un grupo 2-azidoetilo, un grupo 1-azido-1-metiletilo, y preferentemente grupos azido-alquilo de C1-6.

25 Un "grupo alqueno de C2-8" es un grupo hidrocarbonado insaturado compuesto de 2 a 8 átomos de carbono que tiene al menos un doble enlace carbono-carbono. El grupo alqueno de C2-8 puede ser lineal o ramificado. Ejemplos de grupos alqueno de C2-8 incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propeno, un grupo isopropeno, un grupo alilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo, un grupo 1-heptenilo, un grupo 6-heptenilo, un grupo 1-octenilo, un grupo 7-octenilo, un grupo 1-metilalilo, un grupo 2-metilalilo, un grupo 1-metil-2-butenilo y un grupo 2-metil-2-butenilo. Entre estos, se prefieren los grupos alqueno de C2-6.

30 Los ejemplos de "grupos alqueno de C2-8 sustituidos" incluyen grupos haloalqueno tales como un grupo 3-cloro-2-propeno, un grupo 4-cloro-2-butenilo, un grupo 4,4-dicloro-3-butenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-butenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propeno, un grupo 2,3-dicloro-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-propeno, un grupo 2,4,6-tricloro-2-hexenilo, y preferiblemente un grupo haloalqueno de C2-6; y,

35 grupos hidroxialqueno tales como un grupo 3-hidroxi-1-propeno, un grupo 4-hidroxi-1-butenilo, un grupo 1-hidroxialilo, un grupo 1-hidroxi-2-metilalilo, y preferiblemente grupos hidroxilo-alqueno de C2-6.

40 Un "grupo alquino de C2-8" es un grupo hidrocarbonado insaturado compuesto de 2-8 átomos de carbono que tiene al menos un triple enlace carbono-carbono. El grupo alquino de C2-8 puede ser lineal o ramificado. Ejemplos de grupos alquino de C2-8 incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo propargilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo. Entre estos, se prefieren los grupos alquino de C2-6.

45 Los ejemplos de "grupos alquino de C2-8 sustituidos" incluyen grupos haloalquino tales como un grupo 3-cloro-1-propinilo, un grupo 3-cloro-1-butinilo, un grupo 3-bromo-1-butinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo, un grupo 3-bromo-1-hexinilo, un grupo 4,4,6,6-tetrafluoro-1-dodecinilo, un grupo 5,5-dicloro-2-metil-3-pentinilo un grupo 4-cloro-1,1-dimetil-2-butinilo, y preferentemente los grupos haloalquino de C2-6.

50 Un "grupo cicloalquilo de C3-8" es un grupo alquilo compuesto de 3 a 8 átomos de carbono que tiene un resto cíclico. Ejemplos de grupos cicloalquilo de C3-8 incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo y un grupo ciclooctilo. Entre estos, se prefieren los grupos cicloalquilo de C3-6.

55 Los ejemplos de "grupos cicloalquilo de C3-8" incluyen grupos cicloalquilo sustituidos con alquilo, tales como un grupo 2,3,3-trimetilciclobutilo, un grupo 4,4,6,6-tetrametilciclohexilo, un grupo 1,3-dibutilciclohexilo, y preferentemente los grupos cicloalquilo de C3-6 sustituidos con 1 a 3 grupos alquilo de C1-6.

60 Un "grupo cicloalqueno de C4-8" es un grupo alqueno compuesto de 4 a 8 átomos de carbono que tiene un resto cíclico. Ejemplos de grupos cicloalqueno de C4-8 incluyen un grupo 1-ciclobutenilo, un grupo 1-ciclopentenilo, un grupo 3-ciclopentenilo, un grupo 1-ciclohexenilo, un grupo 3-ciclohexenilo, un grupo 3-cicloheptenilo y un grupo 4-ciclooctenilo.

65 Los ejemplos de "grupos cicloalqueno de C4-8 sustituidos" incluyen grupos cicloalqueno sustituidos con alquilo, tales como un grupo 2-metil-3-ciclohexenilo, un grupo 3,4-dimetil-3-ciclohexenilo, y preferentemente los grupos

cicloalqueno de C4-6 sustituidos con 1 a 3 grupos alquilo de C1-6.

Un "grupo arilo de C6-10" es un grupo arilo monocíclico o policíclico que tiene 6 a 10 átomos de carbono. Además, en tanto que al menos uno de los anillos de un grupo arilo policíclico sea un anillo aromático, los anillos restantes pueden ser anillos alicíclicos saturados, anillos alicíclicos insaturados, o anillos aromáticos. Ejemplos de grupos arilo de C6-10 incluyen un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo azuleno, un grupo indenilo, un grupo indanilo y un grupo tetralinilo. Entre estos, se prefiere un grupo fenilo.

Los ejemplos de "grupos arilo de C6-10 sustituidos" incluyen grupos arilo sustituidos con alquilo, grupos arilo sustituidos con halógeno, y grupos arilo sustituidos con alcoxi, tales como un grupo 2-clorofenilo, un grupo 3,5-diclorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 3,5-difluorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo, un grupo 2-metoxi-1-naftilo, y preferiblemente grupos arilo de C6-10 sustituidos con alquilo de C1-6, grupos arilo de C6-10 sustituidos con halógeno, y los grupos arilo sustituidos con alcoxi de C1-6.

Un "grupo heterocíclico" es un grupo que contiene como elementos constituyentes del anillo 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre. El grupo heterocíclico puede ser monocíclico o policíclico.

Los ejemplos de grupos heterocíclicos incluyen grupos heteroarilo de 5 miembros, grupos heteroarilo de 6 miembros, grupos heteroarilo condensados, grupos heterocíclicos saturados y grupos heterocíclicos parcialmente insaturados.

Los ejemplos de grupo heteroarilo de 5 miembros incluyen grupos pirrolilo tales como un grupo pirrol-1-ilo, un grupo pirrol-2-ilo o un grupo pirrol-3-ilo; grupos furilo tales como un grupo furan-2-ilo o un grupo furan-3-ilo; grupos tienilo tales como un grupo tiofen-2-ilo o un grupo tiofen-3-ilo; grupos imidazolilo tales como un grupo imidazol-1-ilo, un grupo imidazol-2-ilo, un grupo imidazol-4-ilo o un grupo imidazol-5-ilo; grupos pirazolilo tales como un grupo pirazol-1-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo o un grupo pirazol-5-ilo; grupos oxazolilo tales como un grupo oxazol-2-ilo, un grupo oxazol-4-ilo o un grupo oxazol-5-ilo; grupos isoxazolilo tales como un grupo isoxazol-3-ilo, un grupo isoxazol-4-ilo o un grupo isoxazol-5-ilo; grupos tiazolilo tales como un grupo tiazol-2-ilo, un grupo tiazol-4-ilo o un grupo tiazol-5-ilo; grupos isotiazolilo tales como un grupo isotiazol-3-ilo, un grupo isotiazol-4-ilo o un grupo isotiazol-5-ilo; grupos triazolilo tales como un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-4-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo o un grupo 1,2,4-triazol-5-ilo; grupos oxadiazolilo tales como un grupo 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo o un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo; grupos tiadiazolilo tales como un grupo 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo; y grupos tetrazolilo tales como un grupo tetrazol-1-ilo o un grupo tetrazol-2-ilo.

Los ejemplos de grupos heteroarilo de 6 miembros incluyen grupos piridilo tales como un grupo piridin-2-ilo, un grupo piridin-3-ilo o un grupo piridin-4-ilo; grupos pirazinilo tales como un grupo pirazin-2-ilo o un grupo pirazin-3-ilo; grupos pirimidinilo tales como un grupo pirimidin-2-ilo, un grupo pirimidin-4-ilo o un grupo pirimidin-5-ilo; y grupos piridazinilo tales como un grupo piridazin-3-ilo o un grupo piridazin-4-ilo.

Los ejemplos de grupos heteroarilo condensados incluyen un grupo indol-1-ilo, un grupo indol-2-ilo, un grupo indol-3-ilo, un grupo indol-4-ilo, un grupo indol-5-ilo, un grupo indol-6-ilo, un grupo indol-7-ilo, un grupo benzofuran-2-ilo, un grupo benzofuran-3-ilo, un grupo benzofuran-4-ilo, un grupo benzofuran-5-ilo, un grupo benzofuran-6-ilo, un grupo benzofuran-7-ilo, un grupo benzotiofen-2-ilo, un grupo benzotiofen-3-ilo, un grupo benzotiofen-4-ilo, un grupo benzotiofen-5-ilo, un grupo benzotiofen-6-ilo, un grupo benzotiofen-7-ilo, un grupo benzoimidazol-1-ilo, un grupo benzoimidazol-2-ilo, un grupo benzoimidazol-4-ilo, un grupo benzoimidazol-5-ilo, un grupo benzoxazol-2-ilo, un grupo benzoxazol-4-ilo, un grupo benzoxazol-5-ilo, un grupo benzotiazol-2-ilo, un grupo benzotiazol-4-ilo, un grupo benzotiazol-5-ilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo, un grupo quinolin-4-ilo, un grupo quinolin-5-ilo, un grupo quinolin-6-ilo, un grupo quinolin-7-ilo, un grupo quinolin-8-ilo, y similares.

Los ejemplos de otros grupos heterocíclicos incluyen grupos heterocíclicos saturados de 3 miembros tales como un grupo aziridin-1-ilo, un grupo aziridin-2-ilo o un grupo oxiranilo; grupos heterocíclicos saturados de 5 miembros tales como un grupo pirrolidin-1-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo pirrolidin-3-ilo, un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo tetrahidrofuran-3-ilo o un grupo [1,3]dioxiran-2-ilo; grupos heterocíclicos saturados de 6 miembros tales como un grupo piperidin-1-ilo, un grupo piperidin-2-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo piperidin-4-ilo, un grupo piperazin-1-ilo, un grupo piperazin-2-ilo, un grupo morfolin-2-ilo, un grupo morfolin-3-ilo o un grupo morfolin-4-ilo; y un grupo 1,3-benzodioxol-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxol-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-7-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-4-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-5-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-6-ilo y un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-7-ilo.

Los ejemplos de "grupos heterocíclicos sustituidos" incluyen un grupo 4-cloro-2-piridinilo, un grupo 3-cloro-2-pirazinilo, un grupo 4-metil-2-piridinilo, un grupo 5-trifluorometil-2-pirimidinilo y un grupo 3-metil-2-quinolilo.

Un "grupo acilo de C1-8" es un grupo en el que un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6, un grupo alqueno

de C2-6, un grupo alquinilo de C2-6, un grupo arilo de C6-7 o un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros está enlazado a un grupo carbonilo.

5 Los ejemplos de grupos acilo de C1-8 incluyen un grupo formilo; grupos alquilcarbonilo tales como un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo n-propilcarbonilo, un grupo n-butilcarbonilo, un grupo pentanoilo, un grupo valerilo, un grupo octanoilo, un grupo i-propilcarbonilo, un grupo i-butilcarbonilo, un grupo pivaloilo o un grupo isovalerilo, y preferiblemente grupos alquilcarbonilo de C1-6; grupos alquenilcarbonilo tales como un grupo acrililo o un grupo metacrililo, y preferentemente grupos alquenilcarbonilo de C2-6; grupos alquilcarbonilo tales como un grupo propionilo, y preferentemente grupos alquilcarbonilo de C2-6; grupos arilcarbonilo de C6-C7 tales como un grupo benzoilo; y grupos carbonilo heterocíclicos tales como un grupo 2-piridilcarbonilo o un grupo tienilcarbonilo.

15 Los ejemplos de "grupos acilo de C1-8 sustituidos" incluyen grupos haloacilo tales como un grupo monofluoroacetilo, un grupo monocloroacetilo, un grupo monobromoacetilo, un grupo difluoroacetilo, un grupo dicloroacetilo, un grupo dibromoacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo, un grupo tribromoacetilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropionilo, un grupo 3,3,3-tricloropropionilo o un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropionilo, y preferentemente grupos haloacilo de C1-8.

20 Un "grupo (1-imino)-alquilo de C1-8" es un grupo iminometilo en el que un grupo alquilo de C1-7 está enlazado a un grupo iminometilo. Ejemplos de grupos (1-imino)-alquilo de C1-8 incluyen un grupo iminometilo, un grupo (1-imino)etilo, un grupo (1-imino)propilo, un grupo (1-imino)butilo, un grupo (1-imino)pentilo, un grupo (1-imino)hexilo y un grupo (1-imino)heptilo. Entre estos, se prefieren los grupos (1-imino)-alquilo de C1-6.

25 Los ejemplos de "grupos (1-imino)-alquilo de C1-8 sustituidos" incluyen grupos (1-hidroxiimino)alquilo tales como un grupo hidroximinometilo, un grupo (1-hidroxiimino)etilo, un grupo (1-hidroxiimino)propilo o un grupo (1-hidroxiimino)butilo, y preferentemente un grupo (1-hidroxiimino)-alquilo de C1-6; y grupos (1-alcoxiimino)alquilo tales como un grupo metoximinometilo, un grupo (1-etoxiimino)metilo, un grupo (1-metoxiimino)etilo, un grupo (1-t-butoxiimino)etilo, un grupo (1-etoxiimino)etilo, y preferentemente grupos (1-(alcoxi C1-6)imino)-alquilo de C1-6.

30 Un "grupo carboxilo sustituido" es un grupo en el que un grupo alquilo de C1-6, un grupo alquenilo de C2-6, un grupo alquinilo de C2-6, un grupo aril C6-10-alquilo de C6-10 o un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros está enlazado a un grupo carbonilo.

35 Los ejemplos de "grupos carboxilo sustituidos" incluyen grupos alcoxicarbonilo tales como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, un grupo i-butoxicarbonilo, un grupo t-butoxicarbonilo, un grupo n-pentiloxicarbonilo, un grupo n-hexiloxicarbonilo, y preferentemente grupos alcoxicarbonilo de C1-6;

40 grupos alqueniloxicarbonilo tales como un grupo viniloxicarbonilo o un grupo aliloxicarbonilo, y preferentemente grupos alqueniloxicarbonilo de C2-6;

45 grupos alquiloxicarbonilo tales como un grupo etiloxicarbonilo o un grupo propargiloxicarbonilo, y preferentemente grupos alquiloxicarbonilo de C2-6;

45 grupos ariloxicarbonilo tales como un grupo fenoxicarbonilo o un grupo naftoxicarbonilo, y preferentemente grupos ariloxicarbonilo de C6-10; y

grupos aralquiloxicarbonilo tales como un grupo benciloxicarbonilo, y preferentemente grupos aril C6-10-alcoxicarbonilo de C1-6.

50 Un "grupo carbamoilo sustituido" es un grupo en el que un grupo alquilo de C1-6, un grupo alquenilo de C2-6, un grupo alquinilo de C2-6, un grupo arilo de C6-10, un grupo aril C6-10-alquilo de C1-6 o un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros está enlazado a un grupo carbamoilo.

55 Los ejemplos de "grupos carbamoilo sustituidos" incluyen grupos monoalquilcarbamoilo o grupos dialquilcarbamoilo, tales como un grupo metilcarbamoilo, un grupo etilcarbamoilo, un grupo dimetilcarbamoilo o un grupo dietilcarbamoilo, y preferentemente grupos mono-alquil C1-6-carbamoilo o grupos di-alquil C1-6-carbamoilo; y grupos monoarilcarbamoilo tales como un grupo fenilcarbamoilo o un grupo 4-metilfenilcarbamoilo, y preferentemente grupos mono-aril C6-10-carbamoilo.

60 Los ejemplos de "grupos hidroxilo sustituidos" incluyen grupos alcoxi tales como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo deciloxi, un grupo dodeciloxi, un grupo lauriloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi, un grupo 1-etilpropoxi, un grupo i-hexiloxi, un grupo 4-metilpentoxi, un grupo 3-metilpentoxi, un grupo 2-metilpentoxi, un grupo 1-metilpentoxi, un grupo 3,3-dimetilbutoxi, un grupo 2,2-dimetilbutoxi, un grupo 1,1-dimetilbutoxi, un grupo 1,2-dimetilbutoxi, un grupo 1,3-dimetilbutoxi, un grupo 2,3-dimetilbutoxi, un grupo 1-etilbutoxi o un grupo 2-etilbutoxi, y preferentemente grupos alcoxi de C1-6;

65

grupos cicloalquilalcoxi tales como un grupo ciclopropilmetiloxi o un grupo 2-ciclopentiletiloxi, y preferiblemente grupos cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6; grupos aralquiloxi tales como un grupo benciloxi, y preferentemente grupos aril C6-10-alcoxi de C1-6; grupos haloalcoxi tales como un grupo clorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo trichlorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo 1-fluoroetoxi, un grupo 1,1-difluoroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi o un grupo pentafluoroetoxi, y preferentemente grupos haloalcoxi de C1-6; grupos alquenoiloxi tales como un grupo viniloxi, un grupo 1-propeniloxi, un grupo aliloxi, un grupo 1-buteniloxi, un grupo 2-buteniloxi, un grupo 3-buteniloxi, un grupo 1-penteniloxi, un grupo 2-penteniloxi, un grupo 3-penteniloxi, un grupo 4-penteniloxi, un grupo 1-hexeniloxi, un grupo 2-hexeniloxi, un grupo 3-hexeniloxi, un grupo 4-hexeniloxi, un grupo 5-hexeniloxi, un grupo 1-metil-2-propeniloxi, un grupo 2-metil-2-propeniloxi, un grupo 1-metil-2-buteniloxi o un grupo 2-metil-2-buteniloxi, y preferentemente grupos alquenoiloxi de C2-6;

grupos alquinoiloxi tales como un grupo etiniloxi, un grupo propiniloxi, un grupo propargiloxi, un grupo 1-butiniloxi, un grupo 2-butiniloxi, un grupo 3-butiniloxi, un grupo 1-pentiniloxi, un grupo 2-pentiniloxi, un grupo 3-pentiniloxi, un grupo 4-pentiniloxi, un grupo 1-hexiniloxi, un grupo 1-metil-2-propiniloxi, un grupo 2-metil-3-butiniloxi, un grupo 1-metil-2-butiniloxi, un grupo 2-metil-3-pentiniloxi o un grupo 1,1-dimetil-2-butiniloxi, y preferentemente grupos alquinoiloxi de C2-6; grupos cicloalquiloxi tales como un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclobutiloxi, un grupo ciclopentiloxi, un grupo ciclohexiloxi, un grupo cicloheptiloxi, un grupo ciclooctiloxi, un grupo 2-metilciclopropiloxi, un grupo 2-etilciclopropiloxi, un grupo 2,3,3-trimetilciclobutiloxi, un grupo 2-metilciclopentiloxi, un grupo 2-etilciclohexiloxi, un grupo 2-etilciclooctiloxi, un grupo 4,4,6,6-tetrametilciclohexiloxi o un grupo 1,3-dibutilciclohexiloxi, y preferentemente grupos cicloalquiloxi de C3-6; grupos ariloxi tales como un grupo feniloxi, un grupo naftiloxi, un grupo azuleniloxi, un grupo indeniloxi, un grupo indaniloxi o un grupo tetraliniloxi, y preferentemente grupos ariloxi de C6-10;

grupos arilalquiloxi (grupos aralquiloxi) tales como un grupo benciloxi, un grupo fenetiloxi o un grupo 2-naftilmetiloxi, y preferentemente grupos aril C6-10-alquiloxi de C1-6;

grupos aciloxi tales como un grupo acetiloxi, un grupo propioniloxi, un grupo n-propilcarboniloxi, un grupo i-propilcarboniloxi, un grupo n-butilcarboniloxi, un grupo i-butilcarboniloxi, un grupo pentanoiloxi o un grupo pivaloiloxi, y preferentemente grupos aciloxi de C1-7;

grupos alcoxycarbonilalquiloxi tales como un grupo metoxycarbonilmetiloxi o un grupo 1-metoxycarbonil-1-metiletiloxi, y preferentemente grupos alcoxi C1-6-carbonil-alcoxi de C1-6; y

grupos trialkilsililoxi tales como un grupo trimetilsililoxi o un grupo t-butildimetilsililoxi, y preferentemente grupos tri-alkil C1-6-sililoxi.

Los ejemplos de "grupos amino sustituidos" incluyen grupos alquilamino tales como un grupo metilamino, un grupo etilamino, un grupo n-propilamino, un grupo n-butilamino, un grupo dimetilamino o un grupo dietilamino, y preferiblemente grupos mono-alkil C1-6-amino o grupos di-alkil C1-6-amino; grupos mono-alkiliden C1-6-amino tales como un grupo metilidenamino o un grupo etilidenamino; grupos monoarilamino tales como un grupo fenilamino o un grupo 4-metilfenilamino, y preferiblemente grupos mono-aril C6-10-amino; grupos diarilamino tales como un grupo bencilamino, y preferentemente grupos aril C6-10-alkil C1-6-amino; grupos acilamino tales como un grupo acetilamino, un grupo trifluoroacetilamino o un grupo benzoilamino, y preferentemente grupos acil C1-6-amino; y grupos alcoxycarbonilamino tales como un grupo metoxycarbonilamino o un grupo t-butoxycarbonilamino, y preferentemente grupos alcoxi C1-6-carbonilamino.

Los ejemplos de "grupos mercapto sustituidos" incluyen grupos alquiltio tales como un grupo metiltio o un grupo etiltio, y preferiblemente grupos alkil C1-6-tio; grupos ariltio tales como un grupo feniltio o un grupo 4-metilfeniltio, y preferentemente grupos aril C6-10-tio; y grupos aciltio tales como un grupo acetiltio o un grupo benzoiltio, y preferentemente grupos acil C1-6-tio.

Los ejemplos de "grupos sulfonilo sustituidos" incluyen grupos alkilsulfonilo tales como un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo i-propilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo i-butilsulfonilo, un grupo s-butilsulfonilo, un grupo t-butilsulfonilo, un grupo n-pentilsulfonilo, un grupo i-pentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 1-etilpropilsulfonilo, un grupo n-hexilsulfonilo o un grupo i-hexilsulfonilo, y preferentemente grupos alkil C1-6-sulfonilo; grupos haloalkilsulfonilo tales como un grupo trifluorometilsulfonilo, y preferentemente grupos haloalkil C1-6-sulfonilo; grupos arilsulfonilo tales como un grupo fenilsulfonilo o un grupo 4-metilfenilsulfonilo, y preferentemente grupos aril C6-10-sulfonilo; grupos sulfo; grupos alcoxysulfonilo tales como un grupo metoxysulfonilo o un grupo etoxysulfonilo, y preferentemente grupos alcoxi C1-6-sulfonilo; grupos sulfamoilo; grupos sulfamoilo tales como un grupo N-metilsulfamoilo, un grupo N-etilsulfamoilo, un grupo N,N-dimetilsulfamoilo o un grupo N,N-dietilsulfamoilo, y preferentemente grupos mono-alkil C1-6-sulfamoilo o grupos di-alkil C1-6-sulfamoilo; y grupos monoarilsulfamoilo tales como un grupo fenilsulfamoilo o un grupo 4-metilfenilsulfamoilo, y preferentemente grupos mono-aril C6-10-sulfamoilo.

Los ejemplos de “grupos halógeno” incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

5  $R^1$  y  $R^2$  pueden formar juntos un anillo de 5 a 8 miembros no sustituido o sustituido, o pueden formar un grupo representado por =O, un grupo representado por  $=CR^aR^b$ , o un grupo representado por =N-R’.

Entonces,  $R^a$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido.  $R^b$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido. R’ representa un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido o un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido.

10 Los ejemplos de grupos alquilo C1-8 no sustituidos o sustituidos en  $R^a$ ,  $R^b$  y R’ son los mismos que los “grupos alquilo de C1-8” ejemplificados en los  $R^1$  a  $R^3$  mencionados anteriormente.

15 Los ejemplos de grupos hidroxilo sustituidos en R’ son los mismos que los “grupos hidroxilo sustituidos” ejemplificados en los  $R^1$  a  $R^3$  mencionados anteriormente.

20 Los ejemplos de anillos de 5 a 8 miembros no sustituidos o sustituidos capaces de ser formados conjuntamente mediante  $R^1$  y  $R^2$  incluyen anillos hidrocarbonados alifáticos tales como un anillo de ciclopropano, un anillo de ciclobutano, un anillo de ciclopentano, un anillo de ciclohexano, un anillo de cicloheptano o un anillo de ciclooctano, y preferentemente anillos de cicloalcano de C3-8; y heterociclos insaturados tales como un anillo de oxirano, un anillo de [1,3]dioxirano, un anillo de dihidro-2H-pirano, un anillo de dihidro-2H-tiopyrano o un anillo de tetrahidropiridins, y preferentemente heterociclos insaturados de 3 a 5 miembros que contienen oxígeno.

25  $[X^1, m]$

$X^1$  representa, respectiva e independientemente, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueno de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquino de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.

30 m representa el número de  $X^1$ , y es un número entero de 0 a 5.

Los ejemplos de grupos representados por  $X^1$  son los mismos que aquellos ejemplificados como grupos representados por  $R^1$  a  $R^3$ .

35 Preferentemente, los ejemplos de  $X^1$  incluyen grupos alquilo de C1-6, grupos haloalquilo de C1-6, grupos alqueno de C2-6, grupos cicloalquilo de C3-8, un grupo hidroxilo, grupos alcoxi de C1-6 y grupos halógeno.

$[X^2, n]$

40  $X^2$  representa, respectiva e independientemente, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueno de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquino de C2-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalqueno de C4-8 no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo (1-imino)-alquilo de C1-8 no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo no sustituido o sustituido, un grupo carbamoilo no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo no sustituido o sustituido, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo mercapto no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.

50 n representa el número de  $X^2$ , y es un número entero de 0 a 3.

Los ejemplos de grupos representados por la  $X^2$  son los mismos que aquellos grupos ejemplificados como grupos representados por  $R^1$  a  $R^3$ .

55 Preferentemente, los ejemplos de  $X^2$  incluyen grupos alquilo de C1-6, grupos haloalquilo de C1-6, grupos aril C6-10-alquilo de C1-6, grupos cicloalquilo de C3-8, grupos arilo de C6-10, grupos acilo de C1-7, grupos alcoxi C1-6-carbonilo, grupos alcoxi de C1-6, un grupo amino, grupos mono-alquil C1-6-amino, grupos di-alquil C1-6-amino, grupos alcoxi C1-6-carbonilamino, grupos alquil C1-6-tio, grupos alquil C1-6-sulfonilo, un grupo halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro.

60 Entonces, cada uno de  $R^1$  a  $R^3$  y uno cualquiera de  $X^2$  pueden formar juntos un anillo de 5 a 8 miembros no sustituido o sustituido.

65 Los ejemplos de anillos de 5 a 8 miembros incluyen anillos hidrocarbonados aromáticos tales como un anillo de benceno; y anillos de cicloalqueno de C5-8 tales como un anillo de ciclopenteno, un anillo de ciclopentadieno, un anillo de ciclohexeno, un anillo de ciclohepteno o un anillo de cicloocteno.

[B, D]

B representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno. En otras palabras, B compone un anillo de piridina en el que "D" se ha condensado, o un anillo de pirazina en el que "D" se ha condensado.

5 D representa un anillo hidrocarbonado de 5 a 7 miembros no sustituido o sustituido con  $X^1$ , o un heterociclo de 5 a 7 miembros no sustituido o sustituido con  $X^1$ .

10 Los ejemplos de anillos hidrocarbonados de 5 a 7 miembros incluyen anillos hidrocarbonados aromáticos tales como un anillo bencénico; anillo de cicloalqueno de C5-7 tales como un anillo de ciclopenteno, un anillo de ciclohexeno o un anillo de ciclohepteno; heterociclos de 5 a 7 miembros aromáticos tales como un anillo de furano, un anillo de tiofeno, un anillo de pirrol, un anillo de imidazol, un anillo de pirazol, un anillo de tiazol, un anillo de oxazol, un anillo de isoxazol, un anillo de piridina, un anillo de pirazina, un anillo de pirimidina, un anillo de piridazina, un anillo de azepina o un anillo de diazepina; y heterociclos de 5 a 7 miembros insaturados tales como un anillo de dihidro-2H-pirano, un anillo de dihidro-2H-tiopirano o un anillo de tetrahidropiridina.

15 Entre estos, resultan preferidos los anillos hidrocarbonados aromáticos, y es más preferible un anillo de benceno. Concretamente, el compuesto según la presente invención es preferentemente un compuesto que tiene un anillo de quinolina o un anillo de quinoxalina.

20  $[A^1, A^2, A^3, A^4]$

$A^1, A^2, A^3$  y  $A^4$  representan, respectiva e independientemente, un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno. Concretamente,  $A^1, A^2, A^3$  y  $A^4$  componen un anillo de benceno, un anillo de piridina, un anillo de piridazina, un anillo de pirimidina, un anillo de pirazina o un anillo de triazina.

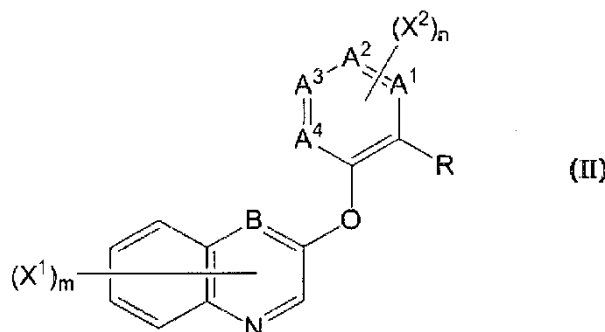
Sin embargo, en el caso de que B sea un átomo de carbono,  $A^1$  a  $A^4$  no son todos átomos de carbono.

30 Entre éstos, resulta preferido un anillo de piridina. Para el anillo de piridina es más preferido un anillo de piridina en el que  $A^1$  es un átomo de nitrógeno.

35 No hay limitaciones particulares en las sales del compuesto de la presente invención con tal de que sean sales agrícola u hortícolamente permisibles. Los ejemplos de sales incluyen sales de ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; sales de ácidos orgánicos tales como ácido acético o ácido láctico; sales de metales alcalinos tales como litio, sodio o potasio; sales de metales alcalino-térreos tales como calcio o magnesio; sales de metales de transición tales como hierro o cobre; y sales de bases orgánicas tales como amoníaco, trietilamina, tributilamina, piridina o hidrazina.

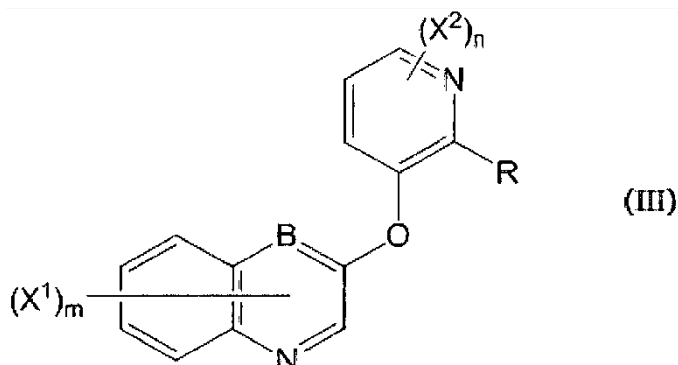
40 El compuesto representado por la fórmula (I) mencionada anteriormente es un compuesto representado por la fórmula (II) (también indicado como "Compuesto (II)").

45 El compuesto representado por la fórmula (II) es un compuesto en el que "D" en la fórmula (I) es un anillo bencénico. A saber, el compuesto de la presente descripción es preferentemente un compuesto que tiene un anillo de quinolina o anillo de quinoxalina.



50 Aquí, R,  $X^1$ , m,  $X^2$ , n,  $A^1, A^2, A^3, A^4$  y B en la fórmula (II) tienen los mismos significados como se describen previamente.

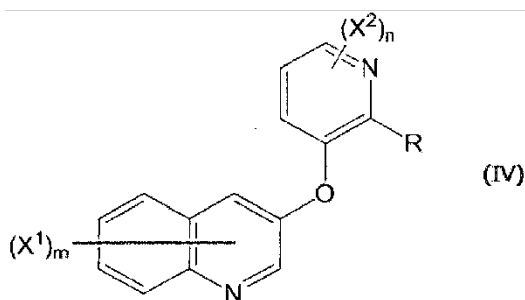
El compuesto representado por la fórmula (II) mencionado anteriormente es preferentemente un compuesto representado por la fórmula (III) (también indicado como "Compuesto (III)") o un compuesto representado por la fórmula (V) (también indicado como "Compuesto (V)").



5 El compuesto representado por la fórmula (III) es un compuesto en el que "A<sup>1</sup>" en la fórmula (II) es un átomo de nitrógeno y "A<sup>2</sup> a A<sup>4</sup>" son átomos de carbono. A saber, el compuesto de la presente descripción es preferiblemente un compuesto que tiene un anillo de quinolina o un anillo de quinoxalina y un anillo de piridina.

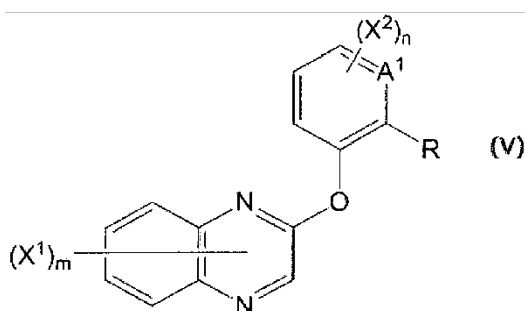
Aquí, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n y B en la fórmula (III) tienen los mismos significados como se describen anteriormente.

10 El compuesto representado por la fórmula (III) mencionada anteriormente es preferentemente un compuesto representado por la fórmula (IV) (también indicado como "Compuesto (IV)").



15 R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup> y n en la fórmula (IV) tienen los mismos significados como se describen previamente.

El compuesto representado por fórmula (IV) es un compuesto en el que "B" en la fórmula (III) es un átomo de carbono. A saber, el compuesto de la presente descripción es preferentemente un compuesto que tiene un anillo de quinolina y un anillo de piperidina.

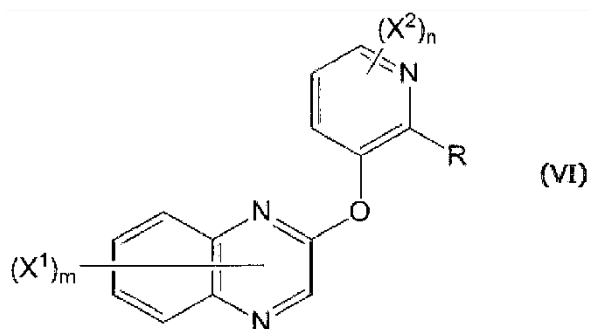


20 El compuesto representado por fórmula (V) es un compuesto en el que "B" en la fórmula (II) es un átomo de nitrógeno, y "A<sup>2</sup> a A<sup>4</sup>" son átomos de carbono. A saber, el compuesto de la presente descripción es preferentemente un compuesto que tiene un anillo de quinoxalina y un anillo de benceno o un anillo de piridina.

25 Aquí, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n y A<sup>1</sup> en la fórmula (V) tienen los mismos significados como se describen previamente.

30 El compuesto representado por la fórmula (V) mencionada anteriormente es preferentemente un compuesto representado por la fórmula (VI) (también indicado como "Compuesto (VI)"). Este compuesto representa el compuesto de la presente invención.





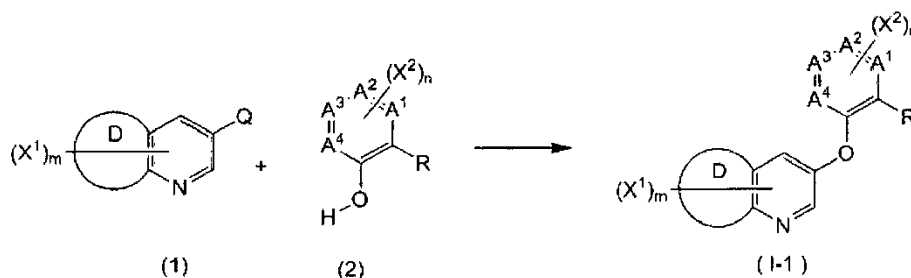
5 El compuesto representado por fórmula (VI) es un compuesto en el que "A<sup>1n</sup>" en la fórmula (V) es un átomo de nitrógeno. A saber, el compuesto de la presente invención es un compuesto que tiene un anillo de quinoxalina y un anillo piridina.

Aquí, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup> y n en la fórmula (VI) tienen los mismos significados como se describen anteriormente.

(Método de producción de compuesto de la presente invención)

10 El compuesto de la presente invención se puede producir según los métodos sintéticos indicados a continuación.

(Método sintético 1)

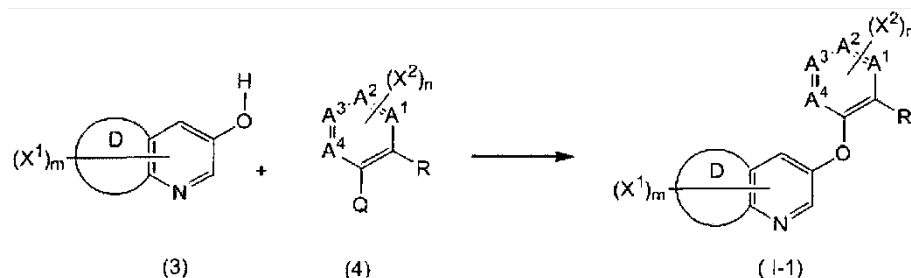


15 En las fórmulas anteriores, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n, D y A<sup>1</sup> a A<sup>4</sup> tienen los mismos significados como se describen previamente. Q representa un átomo de halógeno.

20 Un compuesto representado por la fórmula (I-1) (también indicado como Compuesto (I-1)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (1) con un compuesto representado por la fórmula (2) según un método conocido.

En el método sintético 1, 7,8-difluoro-3-yodoquinolina es un intermedio de producción útil.

25 (Método sintético 2)

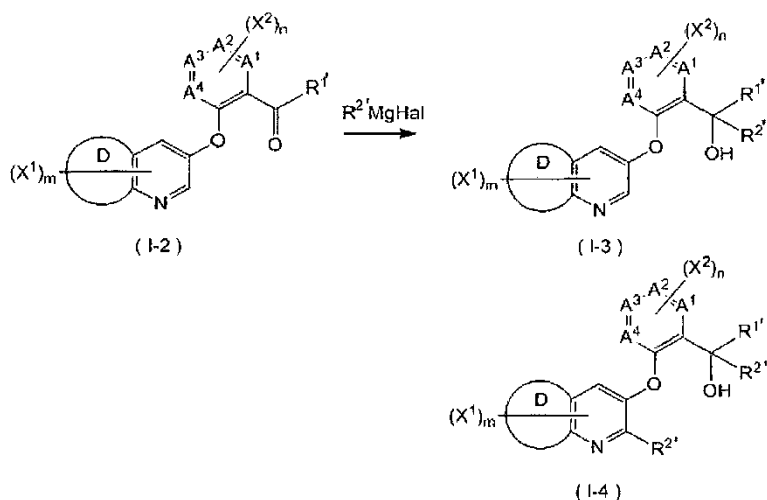


30 En las fórmulas anteriores, Q, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n, D y A<sup>1</sup> a A<sup>4</sup> tienen los mismos significados como se describen anteriormente.

El Compuesto (I-1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (3) con un compuesto representado por la fórmula (4) según un método conocido.

35 En el método sintético 2, 8-fluoro-3-hidroxiquinolina, 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina, 8-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina o 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina es un intermedio de producción útil.

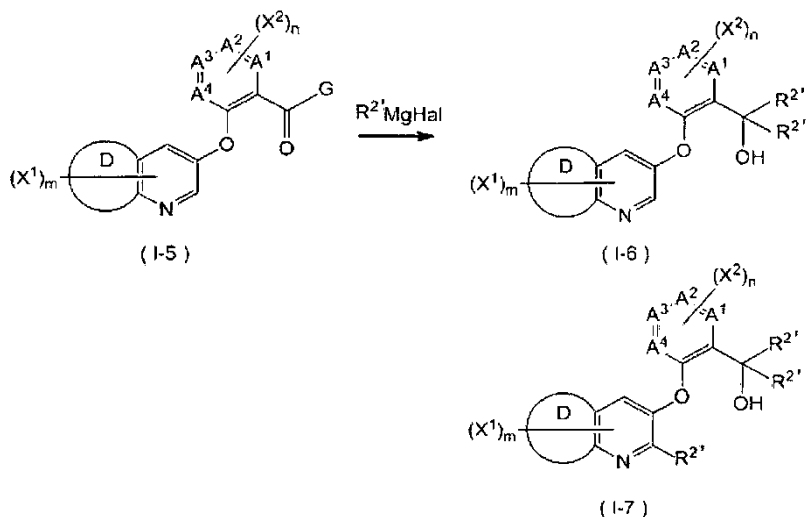
(Método sintético 3)



5 En las fórmulas anteriores,  $X^1$ ,  $m$ ,  $X^2$ ,  $n$ ,  $D$  y  $A^1$  a  $A^4$  tienen los mismos significados como se describen anteriormente.  $R^{1'}$  y  $R^{2'}$  representan grupos alquilo no sustituidos o sustituidos, grupos alquenoilo no sustituidos o sustituidos, o grupos alquinilo no sustituidos o sustituidos, ejemplificados en los  $R^1$  a  $R^3$  mencionados anteriormente. Hal representa un átomo de halógeno.

10 Un compuesto representado por la fórmula (I-3) (también indicado como Compuesto (I-3)) se puede producir haciendo reaccionar 1 equivalente de reactivo de Grignard con un compuesto representado por la fórmula (I-2), que es un tipo de compuesto (I) (también indicado como Compuesto (I-2)). Además, un compuesto representado por la fórmula (I-4) (también indicado como Compuesto (I-4)) se forma además del Compuesto (I-3) cuando se hace reaccionar una cantidad de reactivo de Grignard en exceso de 1 equivalente con Compuesto (I-2), y el Compuesto (I-4) se puede producir haciendo reaccionar con 2 equivalentes de reactivo de Grignard.

(Método sintético 4)

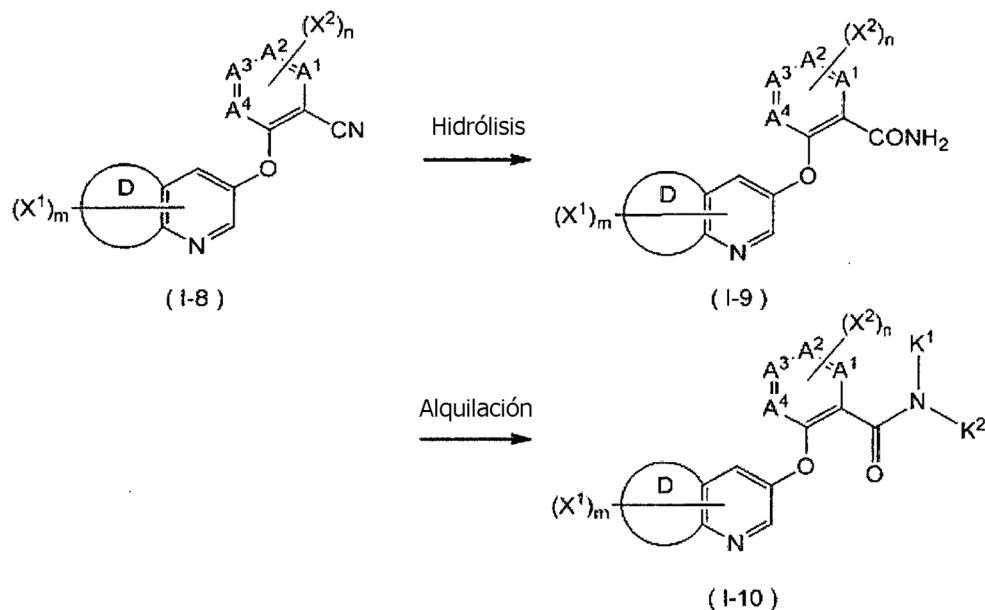


20 En las fórmulas anteriores,  $R^2$ , Hal,  $X^1$ ,  $m$ ,  $X^2$ ,  $n$ ,  $D$  y  $A^1$  a  $A^4$  tienen los mismos significados como se describen previamente. G representa un grupo saliente, tal como un grupo alcoxi o átomo de halógeno.

25 Un compuesto representado por la fórmula (I-6) (también indicado como Compuesto (I-6)) se puede producir haciendo reaccionar 2 equivalentes de reactivo de Grignard con un compuesto representado por la fórmula (I-5), que es un tipo de Compuesto (I) (también indicado como Compuesto (I-5)). Además, cuando se hace reaccionar una cantidad de reactivo de Grignard en exceso de 2 equivalentes con Compuesto (I-5), se forma un compuesto representado por la fórmula (I-7) (también indicado como Compuesto (I-7)) además del Compuesto (I-6), y el Compuesto (I-7) se puede producir haciendo reaccionar con 3 equivalentes de reactivo de Grignard.

30

(Ejemplo 5 de síntesis)

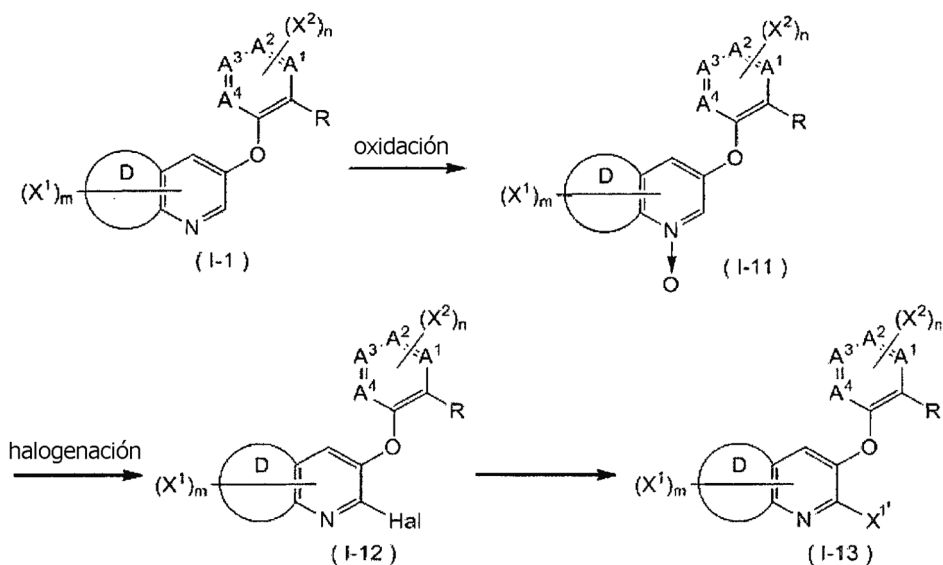


- 5 En las fórmulas anteriores,  $X^1$ ,  $m$ ,  $X^2$ ,  $n$ ,  $D$  y  $A^1$  a  $A^4$  tienen los mismos significados como se describen anteriormente.  $K^1$  y  $K^2$  representan grupos alquilo.

Un compuesto representado por la fórmula (I-9) (también indicado como Compuesto (I-9)) se puede producir hidrolizando un compuesto representado por la fórmula (I-8) (también indicado como Compuesto (I-8)) usando un método conocido. Además, un compuesto representado por la fórmula (I-10) (también indicado como Compuesto (I-10)) se puede sintetizar permitiendo que un agente alquilante actúe en presencia de una base.

10

(Método sintético 6)



- 15 En las fórmulas anteriores, Hal,  $R$ ,  $X^1$ ,  $m$ ,  $X^2$ ,  $n$ ,  $D$  y  $A^1$  a  $A^4$  tienen los mismos significados como se describen previamente.  $X^1$  representa un grupo alcoxi no sustituido o sustituido, un grupo alquilo no sustituido o sustituido, un grupo alqueno no sustituido o sustituido, o un grupo alquililo no sustituido o sustituido.
- 20

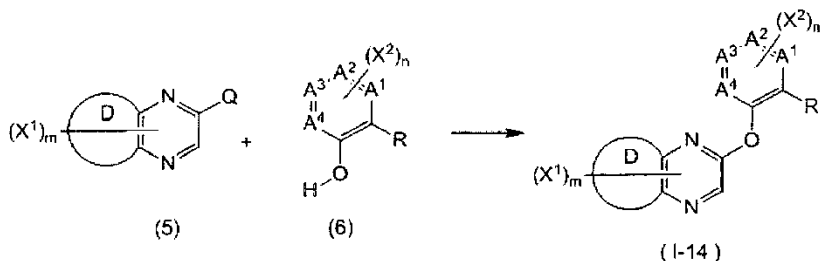
Un compuesto de N-óxido representado por la fórmula (I-11) (también indicado como Compuesto (I-11)) se puede producir oxidando el compuesto (I-1) usando un método conocido, tal como usando un agente oxidante. Un compuesto representado por la fórmula (I-12) (también indicado como Compuesto (I-12)) se puede producir permitiendo que un agente halogenante conocido tal como oxícloruro de fósforo actúe sobre el Compuesto (I-11). Un compuesto representado por la fórmula (I-13) (también indicado como Compuesto (I-13)) se puede sintetizar

25

llevando a cabo una reacción de sustitución nucleófila o una reacción de acoplamiento usando un catalizador organometálico sobre el Compuesto (I-12).

(Método sintético 7)

5



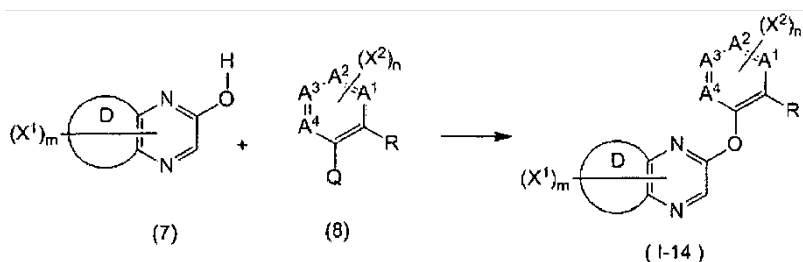
En las fórmulas anteriores, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n, D y A<sup>1</sup> a A<sup>4</sup> tienen los mismos significados como se describen previamente. Q representa un grupo halógeno.

10

Un compuesto representado por la fórmula (I-14) (también indicado como Compuesto (I-14)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (5) y un compuesto representado por la fórmula (6) según un método conocido.

(Método sintético 8)

15



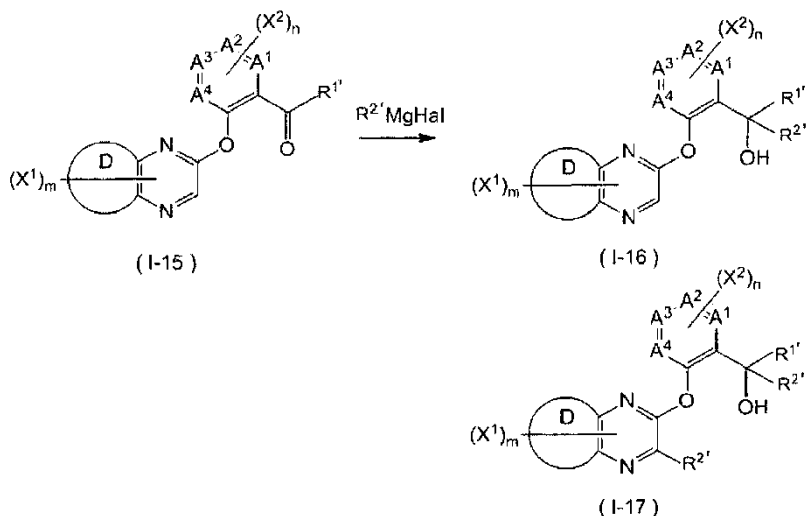
En las fórmulas anteriores, Q, R, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n, D y A<sup>1</sup> a A<sup>4</sup> tienen los mismos significados como se describen previamente.

20

El Compuesto (I-14) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (7) y un compuesto representado por la fórmula (8) según un método conocido.

(Método sintético 9)

25

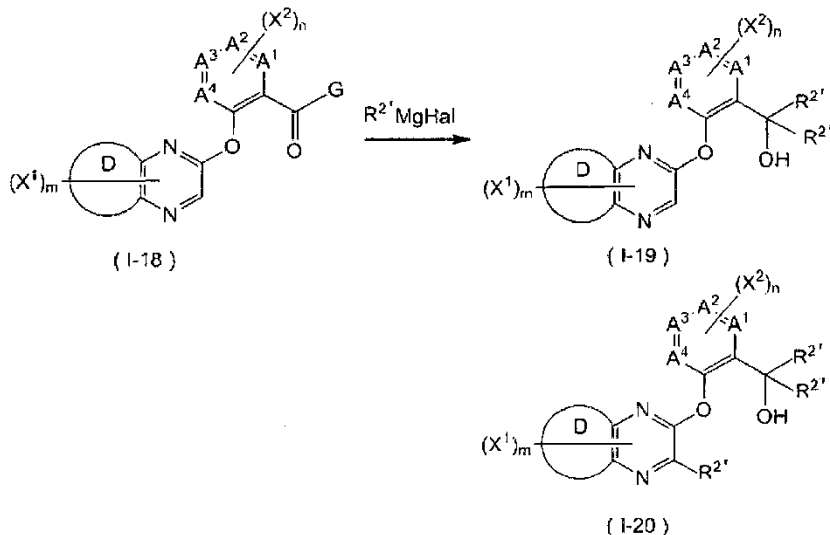


En las fórmulas anteriores, X<sup>1</sup>, m, X<sup>2</sup>, n, D y A<sup>1</sup> a A<sup>4</sup> tienen los mismos significados como se describen previamente. R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan grupos alquilo no sustituidos o sustituidos, grupos alquenilo no sustituidos o sustituidos, o grupos alquinilo no sustituidos o sustituidos, ejemplificados en los R<sup>1</sup> a R<sup>3</sup> mencionados anteriormente. Hal representa un grupo halógeno.

30

5 Un compuesto representado por la fórmula (I-16) (también indicado como Compuesto (I-16)) se puede producir haciendo reaccionar 1 equivalente de reactivo de Grignard ( $R^2MgHal$ ) con un compuesto representado por la fórmula (I-15), que es un tipo de compuesto (I) (también indicado como Compuesto (I-15)). Además, un compuesto representado por la fórmula (I-17) (también indicado como Compuesto (I-17)) se puede producir haciendo reaccionar 2 o más equivalentes de reactivo de Grignard con Compuesto (I-15).

(Ejemplo sintético 10)



10

En las fórmulas anteriores,  $R^2$ , Hal,  $X^1$ , m,  $X^2$ , n, D y  $A^1$  a  $A^4$  tienen los mismos significados como se describen previamente. G representa un grupo saliente, tal como un grupo alcoxi o átomo de halógeno.

15 Un compuesto representado por la fórmula (I-19) (también indicado como Compuesto (I-19)) se puede producir haciendo reaccionar 2 equivalentes de reactivo de Grignard con un compuesto representado por la fórmula (I-18), que es un tipo de Compuesto (I) (también indicado como Compuesto (I-18)). Además, un compuesto representado por la fórmula (I-20) (también indicado como Compuesto (I-20)) se puede producir haciendo reaccionar 3 o más equivalentes de reactivo de Grignard con Compuesto (I-18).

20 Las sales de los Compuestos (I) a (VI) según la presente invención se pueden preparar poniendo en contacto un compuesto de ácido inorgánico, compuesto de ácido orgánico, compuesto de metal alcalino, compuesto de metal alcalino-térreo, compuesto de metal de transición, compuesto de amonio, o similar, con los Compuestos (I) a (VI).

25 En cada una de estas reacciones, el producto diana se puede aislar eficientemente llevando a cabo un procedimiento de post-tratamiento normal usado en el campo de la química orgánica sintética tras terminar la reacción, y llevando a cabo un medio de separación y purificación convencionalmente conocido según sea necesario.

30 La estructura de un producto diana se puede identificar y confirmar, por ejemplo, mediante análisis espectral de RMN <sup>1</sup>H, análisis espectral de IR, espectrometría de masas o análisis elemental.

## 2) Fungicida agrícola u hortícola

35 El fungicida agrícola u hortícola según la presente invención contiene, como principio activo del mismo, al menos un tipo de compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos heterocíclicos nitrogenados mencionados anteriormente representados por la fórmula (VI) y sus sales.

40 El fungicida de la presente invención demuestra excelente actividad fungicida frente a un amplio intervalo de tipos de hongos, tales como oomicetos, ascomicetos, deuteromicetos o basidiomicetos.

El fungicida de la presente invención se puede usar para controlar diversas enfermedades que aparecen durante el cultivo de cosechas agrícolas u hortícolas, incluyendo angiospermas, céspedes y pastizales mediante tratamiento de semillas, pulverización foliar, aplicación en el suelo, aplicación en la superficie del agua, o similar.

45

Por ejemplo, el fungicida de la presente invención se puede usar para controlar los siguientes:

- remolacha: mancha castaña (*Cercospora beticola*), pie negro (*Aphanomyces cochlioides*), pudrición de raíces (*Thanatephorus cucumeris*), o pudrición de hojas (*Thanatephorus cucumeris*);
- 5 cacahuetes: mancha castaña (*Mycosphaerella arachidis*), o viruela tardía (*Mycosphaerella berkeleyi*);
- pepinos: oídio (*Sphaerotheca fuliginea*), mildiú (*Pseudoperonospora cubensis*), tizón del tallo (*Mycosphaerella melonis*), enfermedad de Panamá (*Fusarium oxysporum*), esclerotiniosis (*Sclerotinia sclerotiorum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), antracnosis (*Colletotrichum orbiculare*), sarna (*Cladosporium cucumerinum*), mancha castaña (*Corynespora cassicola*), podredumbre (*Pythium debaryanum*, *Rhizoctonia solani* Kuhn), o mosaico (*Pseudomonas syringae* pv. *Lecrymans*);
- 10 tomates: moho gris (*Botrytis cinerea*), cladosporiosis (*Cladosporium fulvum*), o tizón tardío (*Phytophthora infestans*);
- 15 berenjenas: moho gris (*Botrytis cinerea*), podredumbre negra (*Corynespora melongenae*), oídio (*Erysiphe cichoracearum*), o moho de las hojas (*Mycovellosiella natrassii*);
- fresas: moho gris (*Botrytis cinerea*), oídio (*Sphaerotheca humuli*), antracnosis (*Colletotrichum acutatum*, *Colletotrichum fragariae*), o tizón tardío (*Phytophthora cactorum*);
- 20 cebollas: podredumbre del cuello (*Botrytis allii*), moho gris (*Botrytis cinerea*), tizón de la hoja (*Botrytis squamosa*), o mildiú (*Peronospora destructor*);
- 25 repollo: plasmodio (*Plasmiodiophora brassicae*), podredumbre blanda (*Erwinia carotovora*), o mildiú (*Peronospora parasitica*);
- alubias: esclerotiniosis (*Sclerotinia sclerotiorum*), o moho gris (*Botrytis cinerea*);
- 30 manzanas: oídio (*Podosphaera leucotricha*), sarna (*Venturia inaequalis*), podredumbre por *Monilia* (*Monilinia mali*), moteado del fruto (*Mycosphaerella pomii*), marchitez (*Valsa mali*), corazón mohoso (*Alternaria mali*), roya de manzana (*Gymnosporangium yamadae*), punto del anillo de la manzana (*Botryosphaeria berengeriana*), antracnosis (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*), mancha castaña (*Diplocarpon mali*), mancha de la fruta (*Zygothiala jamaicensis*), o mancha de hollín (*Gloeodes pomigena*);
- 35 caquis: oídio (*Phyllactinia kakicola*), antracnosis (*Gloeosporium kaki*), o mancha cercospora (*Cercospora kaki*);
- melocotones: podredumbre parda (*Monilinia fructicola*), sarna (*Cladosporium carpophilum*), o marchitez por *Phomopsis* (*Phomopsis* sp.);
- 40 melocotón amarillo: podredumbre parda (*Monilinia fructicola*);
- vides: moho gris (*Botrytis cinerea*), oídio (*Uncinula necator*), antracnosis del fruto (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*), mildiú (*Plasmopara viticola*), antracnosis de la uva (*Elsinoe ampelina*), mancha castaña (*Pseudocercospora vitis*), o podredumbre negra (*Guignardia bidwellii*);
- 45 peras: sarna (*Venturia nashicola*), roya (*Gymnosporangium asiaticum*), tizón (*Alternaria kikuchiana*), punto del anillo de la pera (*Botryosphaeria berengeriana*), u oídio (*Phyllactinia mali*);
- 50 planta de té: mancha gris (*Pestalotia theae*), antracnosis (*Colletotrichum theae-sinensis*);
- cítrico: sarna (*Elsinoe fawcetti*), moho azul (*Penicillium italicum*), moho verde común (*Penicillium digitatum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), melanosis (*Diaporthe citri*), o cancrisis (*Xanthomonas campestris* pv. *Citri*);
- 55 trigo: oídio (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*), fusariosis (*Gibberella zeae*), roya de la hoja (*Puccinia recondita*), podredumbre de la raíz por ahogamiento (*Pythium iwayamai*), moho níveo rosado (*Monographella nivalis*), mancha ocular (*Pseudocercospora herpotrichoides*), tizón foliar (*Septoria tritici*), septoriosis (*Leptosphaeria nodorum*), tizón moteado (*Typhula incarnata*), nieve escalda (*Myriosclerotinia borealis*), o mal del pie (*Gaeumannomyces graminis*);
- 60 cebada: mancha listada (*Pyrenophora graminea*), escaldadura (*Rhynchosporium secalis*), o carbón volador (*Ustilago tritici*, *U. nuda*);
- 65 arroz: piriculariosis del arroz (*Pyricularia oryzae*), añublo de la vaina (*Rhizoctonia solani*), Bakanae (*Gibberella fujikuroi*), helmintosporiosis (*Cochliobolus niyabeanus*), pudrición del pie (*Pythium graminicolum*), tizón foliar (*Xanthomonas oryzae*), añublo bacteriano de la panícula (*Burkholderia plantarii*), entorchamiento del arroz (*Acidovorax avenae*), o añublo bacteriano de la panícula (*Burkholderia glumae*);

tabaco: esclerotiniosis (*Sclerotinia sclerotiorum*), u oídio (*Erysiphe cichoracearum*);

tulipas: moho gris (*Botrytis cinerea*);

5

Agrostis: dólar spot (*Sclerotinia borealis*), o tizón (*Pythium aphanidermatum*);

dáctilo: oídio (*Erysiphe graminis*);

10

sojas: mancha púrpura de la soja (*Cercospora kikuchii*), mildiú (*Peronospora Manshurica*), o podredumbre de raíz y tallo (*Phytophthora sojae*); o

patatas y tomates: tizón tardío (*Phytophthora infestans*).

15

Además, el fungicida de la presente invención también demuestra una excelente actividad fungicida frente a organismos resistentes. Los ejemplos de organismos resistentes incluyen: moho gris (*Botrytis cinerea*), mancha castaña de la remolacha (*Cercospora beticola*), sarna del manzano (*Venturia inaequalis*) y sarna del peral (*Venturia nashicola*), que muestran resistencia a fungicidas basados en bencimidazol, tales como tiofanato metilo, benomilo, o carbendazim; y moho gris (*Botrytis cinerea*), que muestra resistencia a bactericidas basados en dicarboximida (tales como vinclozolina, procimidona o iprodiona).

20

Los ejemplos de las enfermedades para las que el fungicida de la presente invención es más preferible incluyen sarna del manzano, moho gris del pepino, oídio del trigo, tizón tardío del tomate, fusariosis del trigo, piriculariosis del arroz, y podredumbre del tallo del pepino.

25

Además, el fungicida de la presente invención provoca poco daño químico, muestra baja toxicidad para peces y animales de sangre caliente, y tiene un grado elevado de seguridad.

30

El fungicida de la presente invención se puede usar en una forma capaz de ser adoptada por sustancias químicas agrícolas, principalmente en forma de una preparación química agrícola tal como un polvo humectable, gránulos, polvo, emulsión, disolución acuosa, suspensión o gránulos humectables.

35

Los ejemplos de aditivos y portadores usados en preparaciones sólidas incluyen polvos vegetales tales como polvo de haba o polvo de trigo, polvos finos minerales tales como tierra de diatomeas, apatita, yeso, talco, bentonita, pirofilita o arcilla, y compuestos orgánicos o inorgánicos tales como benzoato de sodio, urea o sulfato de sodio.

40

Los ejemplos de disolventes usados en preparaciones líquidas incluyen queroseno, xileno e hidrocarburos aromáticos a base de petróleo, ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, alcohol, acetona, tricloroetileno, metil isobutil cetona, aceite mineral, aceite vegetal y agua.

45

Además, a estas preparaciones se les puede añadir un tensioactivo según sea necesario para obtener una forma uniforme y estable.

50

No hay limitaciones particulares sobre los tensioactivos capaces de ser añadidos. Sus ejemplos incluyen tensioactivos no iónicos tales como alquil fenil éteres con polioxietileno añadido, éteres alquílicos con polioxietileno añadido, ésteres de ácidos grasos superiores con polioxietileno añadido, ésteres de ácidos grasos con sorbitán con polioxietileno añadido o triestiril fenil éter con polioxietileno añadido, y sales de ésteres de ácido sulfúrico de alquil fenil éteres con polioxietileno añadido, alquilbencenosulfonatos, sales de ésteres de ácido sulfúrico con alcoholes superiores, alquilnaftalenosulfonatos, policarboxilatos, lignosulfonatos, condensados de formaldehído con alquilnaftalenosulfonatos, y copolímeros de isobutileno-anhídrido maleico.

55

Los polvos humectables, emulsiones, agentes fluibles, disoluciones acuosas, o gránulos humectables, obtenidos de la manera mencionada anteriormente, se usan pulverizándolos sobre plantas en forma de disoluciones, suspensiones, o emulsiones, tras diluirlos con agua hasta una concentración prescrita. Además, los polvos y gránulos se usan pulverizándolos directamente sobre las plantas.

60

Normalmente, la cantidad de principio activo en el fungicida de la presente invención es preferentemente 0,01 a 90% en peso, y más preferentemente 0,05 a 85% en peso, basado en el peso total de la preparación.

65

Aunque la cantidad aplicada del fungicida de la presente invención varía según las condiciones climatológicas, la forma de preparación, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, la localización aplicada, la enfermedad a controlar, el cultivo diana, o similar, normalmente es 1 a 1.000 g, y preferentemente 10 a 100 g, como la cantidad de principio activo, por hectárea.

En el caso de la aplicación diluyendo un polvo humectable, emulsión, suspensión, disolución acuosa, gránulos humectables, o similares, con agua, la concentración aplicada es 1 a 1000 ppm, y preferiblemente 10 a 250 ppm.

El fungicida de la presente invención también se puede mezclar con otros fungicidas, insecticidas, acaricidas, reguladores del crecimiento vegetal, o sinérgicos.

5 A continuación se indican ejemplos típicos de otros fungicidas, insecticidas, acaricidas, y reguladores del crecimiento vegetal, capaces de ser usados mezclándolos con el fungicida de la presente invención.

Fungicidas:

- 10 (1) fungicidas basados en bencimidazol: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato metilo, y similares;
- (2) fungicidas basados en dicarboximida: clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina y similares;
- 15 (3) fungicidas basados en DMI: imazalilo, oxpoconazol, pefurazoato, procloraz, triflumizol, triferina, pirifenox, fenarimol, nuarimol, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, etaconazol, furconazol-cis y similares;
- 20 (4) fungicidas basados en fenilamida: benalaxilo, furalaxilo, metalaxilo, metalaxilo-M, oxadixilo, ofurace y similares;
- (5) fungicidas basados en aminas: aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, piperalina, espiroxamina y similares;
- 25 (6) fungicidas basados en fosforotiolato: EDDP, iprobenfós, pirazofós y similares;
- (7) fungicidas basados en ditiolano: isoprotiolano y similares;
- 30 (8) fungicidas basados carboxiamida: benodanilo, boscalida, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida y similares;
- (9) fungicidas basados en hidroxí-(2-amino)pirimidina: bupirimato, dimetirimol, etirimol y similares;
- 35 (10) fungicidas AP (basados en anilino pirimidina): ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo y similares;
- (11) fungicidas basados en N-fenilcarbamato: dietfencarb y similares;
- 40 (12) fungicidas basados en Qo (inhibidores de Qo): azoxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, kresoxim-metilo, trifloxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobina, orizastrobina, famoxadona, fluoxastrobina, fenamidona, metominofeno y similares;
- (13) fungicidas basados en PP (fenilpirrol): fepiconilo, fludioxonilo y similares;
- 45 (14) fungicidas basados en quinolina: quinoxifena y similares;
- (15) fungicidas basados en AH (hidrocarburos aromáticos): bifenilo, cloroneb, dicloran, quintozeno, tecnazeno, tolctofós-metilo y similares;
- 50 (16) fungicidas basados en MBI-R: ftalida, piroquilona, triciclazol y similares;
- (17) fungicidas basados en MBI-D: carpropamida, diclocimet, fenoxanilo y similares;
- 55 (18) fungicidas basados en SBI: fenhexamida, pirbuticarb, terbinafina y similares;
- (19) fungicidas basados en fenilurea: pencicurón y similares;
- (20) fungicidas basados en Qil (inhibidores de Qi): ciazofamida y similares;
- 60 (21) fungicidas basados en benzamida: zoxamida y similares;
- (22) fungicidas basados en enopiranurona: blastidina, mildiomicina y similares;
- 65 (23) fungicidas basados en hexopiranosilo: kasugamicina y similares;



- (24) fungicidas basados en glucopiranosilo: estreptomina, validamicina y similares;
- (25) fungicidas basados en cianoacetoamida: cimoxanilo y similares;
- 5 (26) fungicidas basados en carbamato: yodocarb, propamocarb, protiocarb, policarbamato y similares;
- (27) fungicidas basados en desacopladores: binapacril, dinocap, ferimuzona, fluazinam y similares;
- 10 (28) fungicidas basados en compuestos de estaño orgánico: acetato de trifenilestaño, cloruro de trifenilestaño, hidróxido de trifenilestaño y similares;
- (29) ésteres de ácido fosfórico: ácido fosforoso, triclofos metilo, fosetilo y similares;
- 15 (30) fungicidas basados en ácido ftalámico: tecloftaram y similares;
- (31) fungicidas basados en benzotriazina: triazóxido y similares;
- (32) fungicidas basados en bencenosulfonamida: flusulfamida y similares;
- 20 (33) fungicidas basados en piridazinona: diclomezina y similares;
- (34) fungicidas basados en CAA (amida de ácido carboxílico): dimetomorf, flumorf, bentiavalicarb, iprovalicarb, mandipropamida y similares;
- 25 (35) fungicidas basados en tetraciclina: oxitetraciclina y similares;
- (36) fungicidas basados en tiocarbamato: metasulfocarb y similares;
- 30 (37) otros compuestos: etridiazol, polioxina, ácido oxolínico, hidroxiisoxazol, octinolina, siltiofam, diflometrim, acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo, etaboxam, ciflufenamida, proquinazida, metrafenona, fluopicolida, hidróxido cúprico, cobre orgánico, azufre, ferbam, manzeb, maneb, metiram, piropineb, tiuram, zineb, ziram, captano, captafol, folpet, clorotalonilo, diclofluanida, tolilfluanida, dodina, guazadina, acetato de iminoctadina, dodecibencenosulfonato de iminoctadina, anilazina, ditianona, cloropicrina, dazomet, quinometionato, ciprofuram, siltiofam, agrobacterium, fluoroimida, y similares;
- 35 Insecticidas/acaricidas, nematocidas, agentes de control de enfermedades de suelos, antihelmínticos:
- (1) agentes basados en (tio)fosfato orgánico: acefato, azametifós, azinfós metilo, azinfós etilo, bromofós etilo, bromfenvinfós, BRP, clorpirifós, clorpirifós metilo, clorpirifós etilo, clorfenvinfós, cadusafós, carbofenotiona, cloretoxifós, clormefós, cumafós, cianofenós, cianofós, CYAP, diazinona, diclorvos, dicrotofós, dimetoato, disulfotona, dimeton-S-metilo, dimetilvinfós, dimeton-S-metilsulfona, dialifós, diazinona, diclofentiona, dioxabenzofós, disulfotona, etiona, etoprofós, etrimfós, EPN, fenamifós, fenitrotiona, fentiona, fensulfotona, fulpirazofós, fonofós, formotiona, fosmetilan, heptenofós, isazofós, yodofenós, isoxationa, iprobenfós, malationa, mevinfós, metamidofós, metidationa, monocrotofós, mecarbam, metacrifós, naled, ometoato, oxidimetón metilo, paraoxona, parationa, parationa metilo, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidona, forato, foxim, pirimifós metilo, pirimifós etilo, profenofós, protiofós, fostiazato, fosfocarb, propafós, propetamfós, protoato, piridafentiona, piraclófós, quinalfós, salitiona, sulprofós, sulfotep, tetraclorvinfós, terbufós, triazofós, triclorfona, tebupirimfós, temefós, tiometona, vamidotona;
- 40 (2) agentes basados en carbamato: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, fenoxicarb, fenotiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato, etiofencarb, fenobucarb, MIPC, MPMC, MTMC, piridafentiona, furatiocarb, XMC, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bendiocarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, cloetocarb, dimetilan, formetanato, isoprocab, metam sodio, metolcarb, promecarb, tiofanox, trimetacarb, xilicarb;
- 55 (3) agentes basados en piretroides: aletrina, bifentrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenprotrina, fenvalerato, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrina, piretrina I, piretrina II, resmetrina, silafluofeno, fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina, acrinatrina, cicloprotrina, halfenprox, flucitrinato, bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, transpermetrina, empentrina, fenflutrina, fenpiritrina, flubrocitrinato, flufenprox, flumetrina, metoflutrina, fenotrina, protifenbuto, piresmetrina, tareletrina;
- 60 (4) reguladores del crecimiento:
- 65 (a) inhibidores de la síntesis de quitina: clorfluazurona, diflubenzurona, fluciclozurón, flufenoxurón,

hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón bistriflurón, noviflumurón, buprofezina, hexitiazox, etoxazol, clofentezina, fluazurón, penflurón;

(b) agonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenoazida, tebufenozida, cromafenozida, azadiractina;

(c) miméticos de hormonas juveniles: piriproxifeno, metopreno, diofenolan, epofenonato, hidropreno, quinopreno, tripreno;

(d) inhibidores de biosíntesis de lípidos: espiroclorfenol, espiromesifeno, espirotetramato, flonicamida;

(5) agonistas/antagonistas de receptores de nicotina: acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprida, tiametoxam, nitiazina, nicotina, bensultap, cartap, flupiradifurona;

(6) compuestos antagonistas de GABA:

(a) acetoprol, etipiro, fipronilo, vaniliprol, pirafluprol, piriprol;

(b) compuestos basados en cloro orgánico; camfleclor, clordano, endosulfano, HCH,  $\gamma$ -HCH, heptaclor, metoxiclor;

(7) insecticidas de lactonas macrocíclicas: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad, ivermectina, selamectina, doramectina, epinomectina, moxidectina;

(8) compuestos de METI I: fenazaquina, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, hidrametilnona, fenpiroximato, pirimidifeno, dicofol;

(9) compuestos de METI II y III: acequinocilo, fluacriprim, rotenona;

(10) compuestos de agentes desacopladores: clorfenapir, binapacril, dinobutona, dinocap, DNOC;

(11) compuestos inhibidores de la fosforilación oxidativa: cihexatina, diafentiurona, óxido de fenbutatina, propargito, azociclotina;

(12) compuestos inhibidores de la muda: ciromazina;

(13) compuestos inhibidores de oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo;

(14) compuestos bloqueadores de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

(15) plaguicidas microbianos: agentes BT, agente víricos patógenos de insectos, agente fúngicos patógenos de insectos, agente fúngicos patógenos de nematodos; especies de Bacillus, Beauveria bassiana, Metarhizium anisopliae, especies de Paecilomyces, turingiensina, especies de Verticillium;

(16) agonistas de receptor de latrofilina: depsipéptido, depsipéptido cíclico, depsipéptido cíclico de 24 miembros, emodépsido;

(18) agonistas octopaminérgicos: amitraz;

(19) agonistas de derivados de rianodina: flubendiamida, clorantraniliprol, ciantraniliprol;

(20) inhibidores de ATPasa activada por magnesio: tiociclam, tiosultap, toxina de Nereis;

(21) inhibidores de la digestión: pimetrozina;

(22) inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, etoxazol;

(23) otros: benclotiaz, bifenazato, piridalilo, azufre, cienopirafeno, ciflumetofeno, amidoflumet, tetradifon, clordimeform, 1,3-dicloropropeno, DCIP, fenisobromolato, benzomato, metaldehído, spinetoram, pirifluquinazona, benzoximato, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, cloropicrina, clotiazoben, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanilo, flubencimina, flufenzina, gosiplura, japonilura, metoxadiazona, petróleo, oleato de potasio, amida de azufre, tetrasul, triaraceno;

(24) agentes antihelmínticos

(a) agentes basados en bencimidazol: fenbendazol, albendazol, triclabendazol, oxicarbendazol;

(b) agentes basados en salicilanilida: closantel, oxiclozanida;

(c) agentes basados en fenol sustituido: nitroxinilo;

5 (d) agentes basados en pirimidina: pirantel;

(e) agentes basados en imidazotiazol: levamisol;

10 (f) agentes basados en tetrahidropirimidina: praziquantel;

(g) otros agentes antihelmínticos: ciclodieno, ryania, clorsulon, metronidazol;

Reguladores del crecimiento de las plantas:

15 ácido abscísico, ácido indolbutírico, uniconazol, eticlozato, etefon, cloxifonac, clormequat, extracto de chlorella, peróxido de calcio, cianamida, diclorprop, giberelina, daminozida, alcohol decílico, trinexapac-etilo, cloruro de mepiquat, paclobutrazol, cera de parafina, butóxido de piperonilo, piraflufen-etilo, flurprimidol, prohidrojasmona, prohexadiona sal de calcio, bencilaminopurina, pendimetalina, forclorfenurón, maleato de hidrozida de potasio, 1-naftilacetamida, 4-CPA, MCPB, colina, sulfato de oxiquinolona, eticlozato, butralina, 1-metilciclopropeno, e hidrocloreuro de aviglicina.

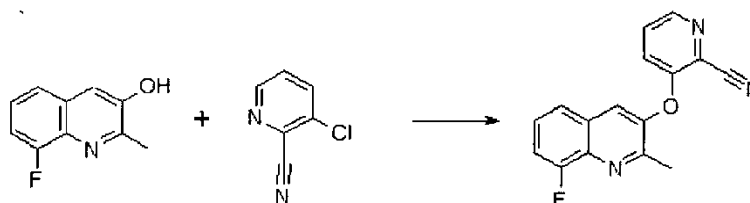
20

### Ejemplos

25 Aunque lo siguiente proporciona una explicación con mayor detalle de la presente invención al indicar ejemplos de la misma, la presente invención no está limitada a los siguientes ejemplos.

#### Ejemplo 1 de Referencia

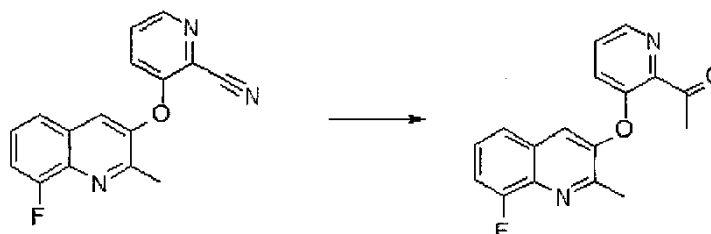
30 Síntesis de 3-(2-ciano-piridin-3-iloxi)-8-fluoro-2-metilquinolina



35 Se disolvieron 4,9 g de 8-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina, 3,2 g de 3-cloro-2-cianopiridina y 3,8 g de carbonato de potasio en 20 ml de N-metilpirrolidona, seguido de agitación durante 3 horas a 130°C. Subsiguientemente, la disolución de la reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente, seguido de adición de agua y extracción con acetato de etilo. El extracto se lavó con disolución salina saturada y se secó con sulfato de magnesio, seguido de separación del disolvente mediante destilación a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 5,37 g de 3-(2-ciano-piridin-3-iloxi)-8-fluoro-2-metilquinolina.

#### 40 Ejemplo 2 de Referencia

Síntesis de 1-[3-(2-metil-8-fluoroquinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-etanona (Compuesto nº a-9)



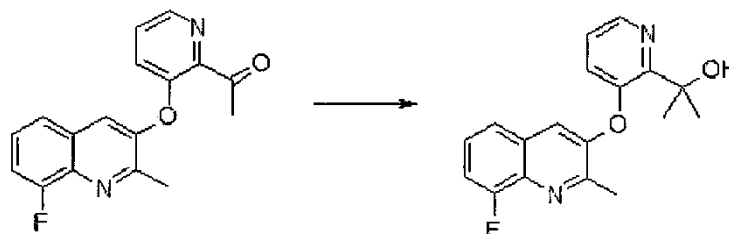
45 Se disolvieron 2,51 g de 3-(2-ciano-piridin-3-iloxi)-8-fluoro-2-metilquinolina en 30 ml de tetrahidrofurano deshidratado. Se gotearon 3,6 ml de una disolución tetrahidrofuránica 3 M de cloruro de metilmagnesio mientras se enfría con hielo, seguido de agitación de la disolución de la reacción durante 2 horas mientras se continúa el enfriamiento con hielo. A continuación, la disolución de la reacción se añadió a una disolución 1 N de ácido clorhídrico, seguido de neutralización con bicarbonato de sodio acuoso y después extracción con acetato de etilo. El extracto se lavó con disolución salina saturada y se secó con sulfato de magnesio seguido de separación del disolvente mediante destilación a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en

50

columna en gel de sílice para obtener 1,7 g de 1-[3-(2-metil-8-fluoroquinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-etanona.

### Ejemplo 3 de Referencia

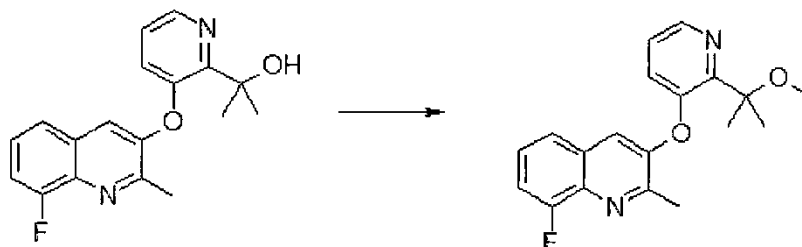
- 5 Síntesis de 2-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)piridin-2-il]propan-2-ol (Compuesto nº a-7)



- 10 Se disolvieron 1,58 g de 1-[3-(2-metil-8-fluoroquinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-etanona en 20 ml de tetrahidrofurano deshidratado. Se gotearon 2,7 ml de una disolución tetrahidrofuránica 3 M de cloruro de metilmagnesio mientras se enfría con hielo, seguido de agitación de la disolución de la reacción durante 3 horas mientras se continúa el enfriamiento con hielo. A continuación, la disolución de la reacción se añadió a una disolución 1 N de ácido clorhídrico, seguido de neutralización con bicarbonato de sodio acuoso y después extrayendo con acetato de etilo. El extracto se lavó con disolución salina saturada y se secó con sulfato de magnesio, seguido de separación del disolvente mediante destilación a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 1,69 g de 2-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)piridin-2-il]propan-2-ol.

### Ejemplo 4 de Referencia

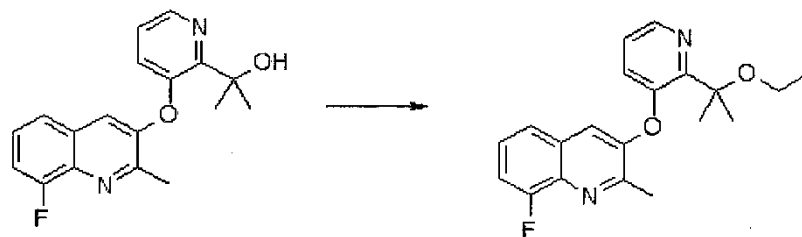
- 20 Síntesis de 3-[2-(2-metoxi-2-propil)piridin-3-iloxi]-8-fluoro-2-metilquinolina (Compuesto nº a-16)



- 25 Se disolvieron 0,50 g de 2-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)piridin-2-il]propan-2-ol y 0,45 g de yoduro de metilo en 10 ml de dimetilformamida. Se le añadieron 64 mg de hidruro de sodio (suspensión en aceite al 60%) mientras se enfría con hielo, seguido de agitación de la disolución de la reacción durante 2 horas mientras se continúa el enfriamiento con hielo. Subsiguientemente, la disolución de la reacción se vertió en agua con hielo, seguido de extracción con acetato de etilo. El extracto se lavó con disolución salina saturada y se secó con sulfato de magnesio seguido de separación del disolvente mediante destilación a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,15 g de 3-[2-(2-metoxi-2-propil)piridin-3-iloxi]-8-fluoro-2-metilquinolina.

### Ejemplo 5 de Referencia

- 35 Síntesis de 3-[2-(2-etoxi-2-propil)piridin-3-iloxi]-8-fluoro-2-metilquinolina (Compuesto nº a-56)



- 40 Se disolvieron 0,53 g de 2-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)piridin-2-il]propan-2-ol en 10 ml de cloroformo. Se le añadieron 0,61 g de cloruro de tionilo a temperatura ambiente, seguido de agitación durante 30 minutos a temperatura ambiente. Subsiguientemente, el disolvente y el cloruro de tionilo en exceso se separaron mediante destilación a presión reducida, y después el residuo se disolvió en etanol, seguido de reflujo durante 1 hora. A continuación, la disolución de la reacción se concentró a presión reducida, y se añadió agua al residuo seguido de

extracción con acetato de etilo. El extracto se lavó con disolución salina saturada y se secó con sulfato de magnesio, seguido de separación del disolvente mediante destilación a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,19 g de 3-[2-(2-etoxi-2-propil)piridin-3-iloxi]-8-fluoro-2-metilquinolina.

5

### Ejemplo 6 de Referencia

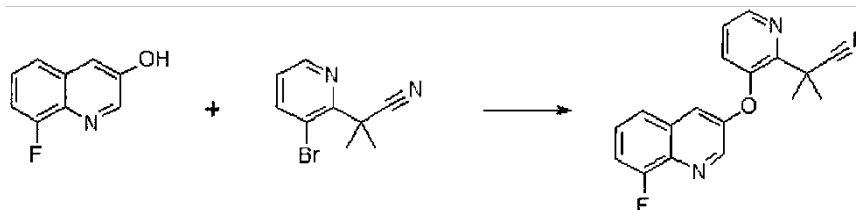
Síntesis de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropionitrilo (Compuesto nº a-11) Etapa 1) Síntesis de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metilpropionitrilo

10

Se disolvieron 2,25 g de (3-bromo-piridin-2-il)-acetonitrilo en 30 ml de dimetilformamida. Se le añadieron 1,09 g de hidruro de sodio (suspensión en aceite al 60%) a 0°C. A continuación, se añadieron 3,9 g de yoduro de metilo a la disolución de la reacción, seguido de agitación durante 1,5 horas. A continuación, se añadió ácido clorhídrico diluido seguido de extracción con acetato de etilo. El disolvente de la capa orgánica se separó mediante destilación seguido de purificación con cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 2,68 g de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metilpropionitrilo.

15

Etapa 2) Síntesis de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropionitrilo



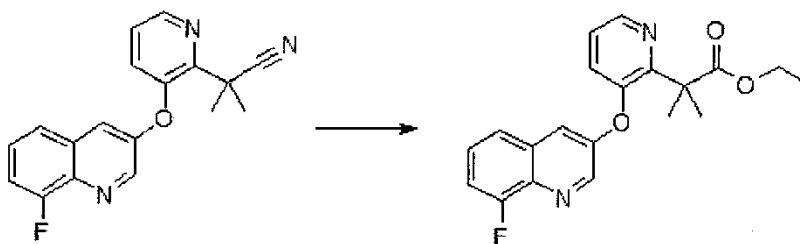
20

Se disolvieron 1,35 g de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metilpropionitrilo en 6 ml de N-metilpirrolidona. Se le añadieron 0,82 g de 8-fluoro-3-hidroxiquinolina, 1,95 g de carbonato de cesio, 0,18 g de dipivaloilmetano y 0,50 g de cloruro de cobre (I), seguido de agitación durante 23 horas a 130°C. Subsiguientemente, la mezcla de reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente y se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,46 g de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropionitrilo.

25

### Ejemplo 7 de Referencia

30 Síntesis de éster etílico del ácido 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropiónico (Compuesto nº a-12)



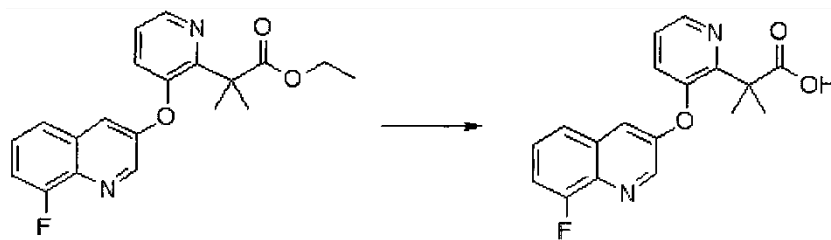
35

Se añadieron 2 ml de etanol y 2 ml de ácido sulfúrico concentrado a 0,38 g de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropionitrilo. La mezcla se agitó durante 6 horas a 100°C. Subsiguientemente, se le añadió una disolución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio para detener la reacción. El resultante se extrajo entonces con acetato de etilo, seguido de separación de la capa orgánica mediante destilación del disolvente. A continuación, el resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,24 g de éster etílico del ácido 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropiónico.

40

### Ejemplo 8 de Referencia

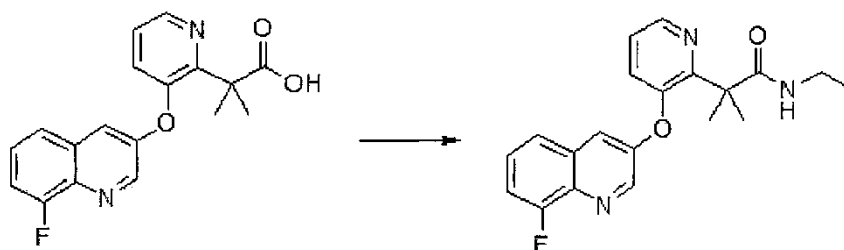
Síntesis de ácido 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropiónico (Compuesto nº a-19)



Se disolvieron 0,33 g de éster etílico del ácido 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropiónico en 1 ml de etanol. Se le añadieron 2 ml de disolución acuosa 4 N de hidróxido de sodio, seguido de calentamiento a reflujo durante 48 horas. Subsiguientemente, se le añadió ácido clorhídrico diluido, seguido de extracción con acetato de etilo y separación de la capa orgánica mediante destilación del disolvente para obtener 0,25 g de ácido 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropiónico.

### Ejemplo 9 de Referencia

Síntesis de N-etil-2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-isobutilamida (Compuesto nº a-55)



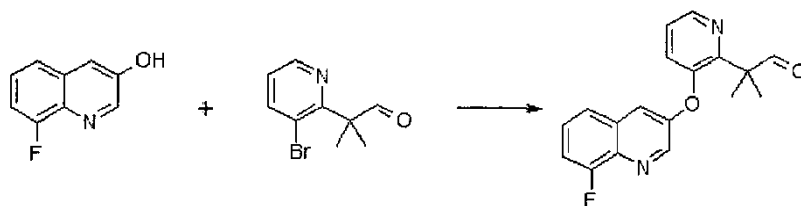
Se disolvieron 0,10 g de ácido 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metilpropiónico y 0,08 g de diisopropiletilamina en 1,2 ml de dimetilformamida. Se le añadieron 0,3 ml de una disolución tetrahidrofuránica 2,0 M de etilamina y 0,17 g de hexafluorofosfato de o-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, seguido de agitación durante 14 horas a temperatura ambiente. A continuación, la disolución de la reacción se extrajo con acetato de etilo, seguido de separación de la capa orgánica mediante destilación del disolvente. El resultante se purificó entonces mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,10 g de N-etil-2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-isobutilamida.

### Ejemplo 10 de Referencia

Síntesis de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metil-propioaldehído (Compuesto nº a-21) Etapa 1) Síntesis de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metilpropioaldehído

Se disolvieron 1,8 g de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metil-propionitrilo en 20 ml de tolueno. Se le añadieron 5,9 ml de una disolución toluénica al 25% en peso de hidruro de diisobutilaluminio a 0°C. La mezcla se agitó durante 17 horas a temperatura ambiente. A continuación, se le añadió ácido clorhídrico diluido para disolver el hidruro de diisobutilaluminio sin reaccionar. A continuación, se le añadió disolución saturada acuosa de hidrogenocarbonato de sodio seguido de extracción con acetato de etilo. El disolvente de la fase orgánica se separó mediante destilación, seguido de purificación mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,44 g de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metil-propioaldehído.

Etapa 2) Síntesis de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metil-propioaldehído

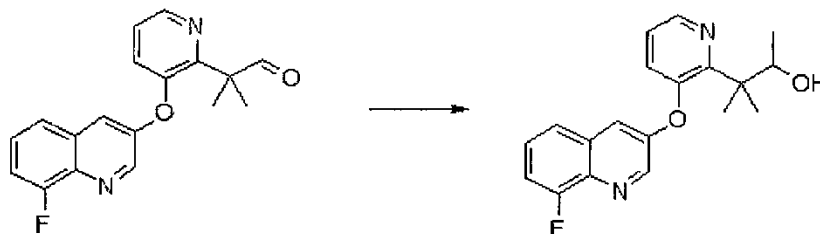


Se disolvieron 0,41 g de 2-(3-bromo-piridin-2-il)-2-metil-propioaldehído en 4 ml de N-metilpirrolidona. Se le añadieron 0,59 g de 8-fluoro-3-hidroxiquinolina, 1,2 g de carbonato de cesio, 0,07 g de dipivaloilmetano y 0,18 g de cloruro de cobre (I), seguido de agitación durante 16 horas a 130°C. A continuación, la disolución de la reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente y se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,19 g de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metil-propioaldehído.

**Ejemplo 11 de Referencia**

Síntesis de 3-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-3-metil-butan-2-ol

5

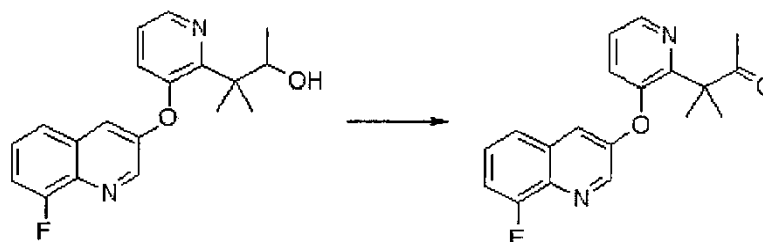


Se disolvieron 0,10 g de 2-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-2-metil-propionaldehído en 3 ml de tetrahidrofurano. Se le añadieron 0,2 ml de una disolución tetrahidrofuránica 3,0 M de cloruro de metilmagnesio, seguido de agitación durante 30 minutos a 0°C. A continuación, se le añadió agua para detener la reacción. El resultante se extrajo entonces con acetato de etilo, seguido de separación de la capa orgánica mediante destilación del disolvente y purificación mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,07 g de 3-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-3-metil-butan-2-ol.

10

**Ejemplo 12 de Referencia**

Síntesis de 3-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-3-metil-butan-2-ona (Compuesto nº a-15)



20

Se disolvieron 0,07 g de 3-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-3-metil-butan-2-ol en 3 ml de diclorometano. Se le añadieron 0,27 g de reactivo de Dess-Martin a 0°C, seguido de agitación durante 30 minutos. A continuación, la disolución de la reacción se concentró, seguido de purificación mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,04 g de 3-[3-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-piridin-2-il]-3-metil-butan-2-ona.

25

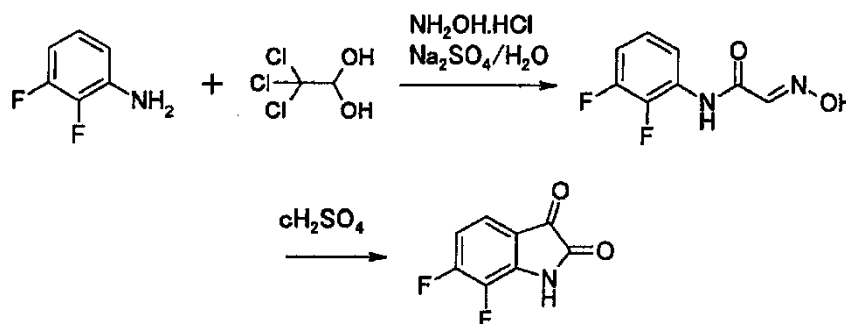
Aunque lo siguiente proporciona una explicación con mayor detalle de la producción de intermedios del compuesto según la presente invención usando ejemplos de referencia, la producción de intermedios no está limitada a los siguientes ejemplos de referencia.

**Ejemplo 1 de Referencia**

Síntesis de 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina

Etapa 1) Síntesis de 6,7-difluoroisatina

35



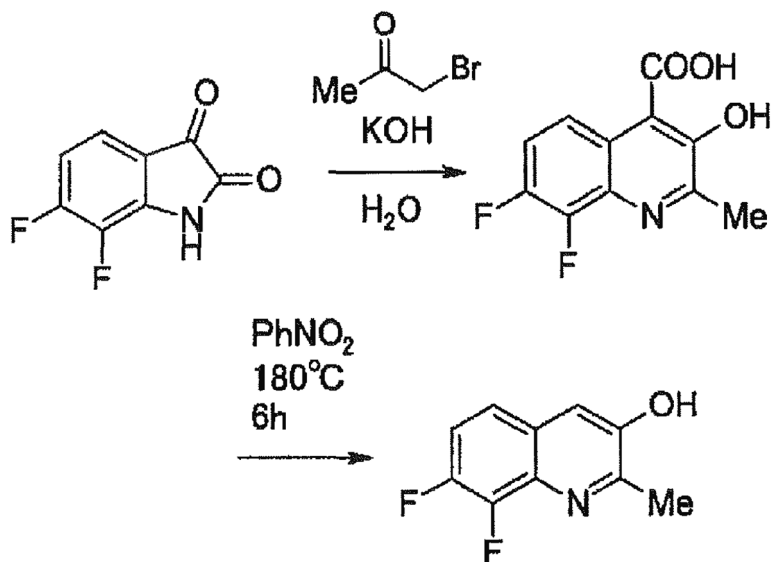
Se añadieron 15,7 g de 2,3-difluoroanilina a 825 ml de agua, seguido de adición de 24,2 g de tricloroacetaldehído, 30,8 g de hidrocloreuro de hidroxiamina y 138,6 g de sulfato de sodio anhidro y de agitación de la mezcla durante 10 horas a 50°C. Después de dejar enfriar a temperatura ambiente, se le añadieron 44 ml de ácido clorhídrico 2 N

40

seguido de agitación de la mezcla durante 30 minutos. A continuación, los cristales se eliminaron mediante filtración. Los cristales resultantes se secaron, y después se añadieron a ácido sulfúrico concentrado caliente a 70°C, seguido de agitación de la mezcla durante 1 hora a 80°C hasta 90°C. La disolución de la reacción se vertió entonces sobre hielo y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina saturada y se secó con sulfato de magnesio, seguido de separación del disolvente mediante destilación a presión reducida para obtener 26 g de un producto bruto de 6,7-difluoroisatina.

5

Etapa 2) Síntesis de 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina



10

Se añadieron 41 g del producto bruto de 6,7-difluoroisatina a 200 ml de agua, seguido de la adición de 75,3 g (6 equivalentes) de hidróxido de potasio mientras se enfría con hielo y se agita la mezcla durante 30 minutos. Se gotearon 42 g (1,4 equivalentes) de bromoacetofenona en la suspensión resultante a una temperatura de 20°C hasta 25°C. Tras terminar el goteo, la mezcla de reacción se agitó toda la noche a temperatura ambiente. El resultante se neutralizó entonces con ácido clorhídrico concentrado. Los cristales precipitados se eliminaron mediante filtración y se lavaron con una pequeña cantidad de agua. Los cristales resultantes se secaron, y después se añadieron a 100 ml de nitrobencono poco a poco a 130°C hasta 140°C. Tras terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 150°C. Después de enfriar la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente, los cristales precipitados se lavaron con cloroformo para obtener 26,3 g de 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina.

15

20

Los resultados del análisis de RMN fueron como se indican a continuación.

RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  2,57 (s, 3H), 7,4-7,7 (m, 3H), 10,60 (bs, 1H)

25

La 8-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina se produjo según el mismo método.

Los resultados del análisis de RMN fueron como se indican a continuación.

RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  2,56 (s, 3H), 7,2-7,6 (m, 4H), 10,53 (bs, 1H)

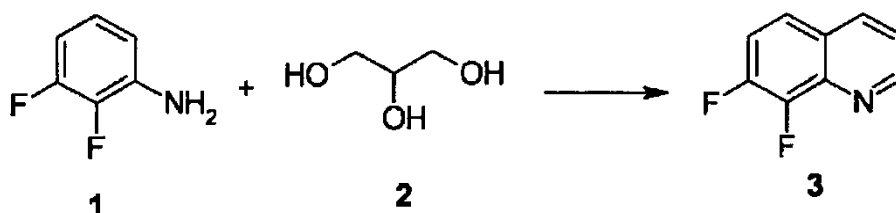
30

### Ejemplo 2 de Referencia

Síntesis de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina

35

Etapa 1) Síntesis de 7,8-difluoroquinolina



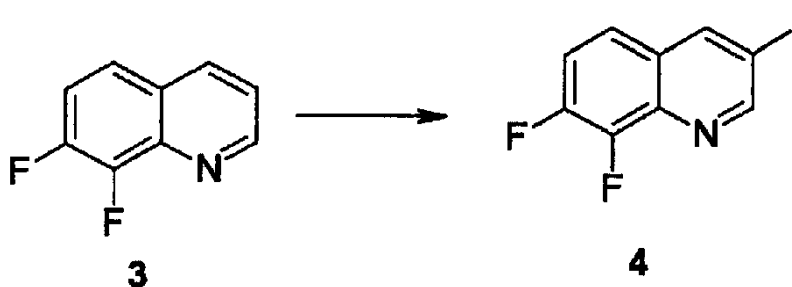
Se colocaron 607,7 g (49,57 moles) de ácido sulfúrico al 80% en un matraz de fondo ovalado de 3 l que contiene un

40



agitador, seguido de enfriamiento hasta 0°C. Se le añadieron gradualmente 160,0 g (1,24 moles) de 2,3-difluoroanilina. Tras terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Se le añadieron entonces 1,85 g (12,3 mmoles) de yoduro de sodio, seguido de calentamiento con un baño de aceite a 150°C. Cuando la temperatura del líquido alcanzó 150°C, se gotearon en él 125,5 g (1,36 moles) de glicerina durante el transcurso de 1 hora. Tras terminar el goteo, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 150°C. A continuación, la temperatura del baño de aceite se elevó hasta 180°C. El agua se separó mediante destilación durante el transcurso de 2 horas usando un aparato de destilación. Tras confirmar la eliminación de los materiales brutos, la mezcla de reacción se neutralizó con una disolución acuosa 10 N de hidróxido de sodio mientras se enfría en un baño de agua con hielo (temperatura interna: 60°C hasta 70°C). Tras neutralizar, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo antes de que la temperatura interna volviera a la temperatura ambiente, y después el extracto se secó con sulfato de magnesio, se filtró, y se concentró. El producto bruto resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano: acetato de etilo) para obtener 185,5 g (91%) de 7,8-difluoroquinolina en forma de un sólido marrón claro.

15 Etapa 2) Síntesis de 7,8-difluoro-3-yodoquinolina



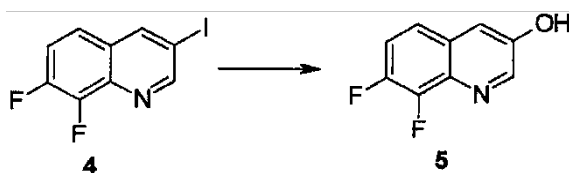
20 Se colocaron 185,5 g (1,12 moles) de 7,8-difluoroquinolina, 505,4 g (2,25 moles) de N-yodosuccinimida y 927 ml de ácido acético en un matraz de fondo ovalado de 3 l que contiene un agitador, seguido de agitación de la mezcla durante 30 horas a 90°C. Después de enfriar el resultante, los cristales precipitados se filtraron y se secaron. El filtrado se concentró a presión reducida, y el ácido acético restante se neutralizó con hidrogenocarbonato de sodio, seguido de extracción con acetato de etilo. El extracto se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. El producto bruto resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo).

25 El resultante se combinó con los cristales obtenidos previamente para obtener 227,2 g (70%) de 8-difluoro-3-yodoquinolina en forma de un sólido marrón claro.

Los resultados del análisis de RMN fueron como se indican a continuación.

30 RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,39-7,51 (m, 2H), 8,55 (m, 1H), 9,08 (d, 1H, J = 2,1 Hz)

Etapa 3) Síntesis de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina



35 Se colocaron 227,2 g (0,78 moles) de 7,8-difluoro-3-yodoquinolina, 600 ml de dimetilsulfóxido y 600 ml de agua en un matraz de fondo ovalado de 3 l, seguido de la adición de 131,5 g (2,34 moles) de hidróxido de potasio, 14,8 g (0,078 moles) de CuI y 28,1 g (0,156 moles) de 1,10-fenantrolina. La mezcla de reacción se calentó hasta 100°C con un baño de aceite, seguido de agitación de la mezcla durante 24 horas. Después de dejar enfriar, se le añadieron acetato de etilo y agua, seguido de eliminación de la capa orgánica. La capa acuosa resultante se neutralizó con ácido clorhídrico concentrado. Los cristales precipitados se filtraron y se secaron.

45 El filtrado se extrajo con acetato de etilo, seguido del secado con sulfato de magnesio, filtrado y concentración. El producto bruto resultante se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo).

El resultante se combinó con los cristales obtenidos previamente para obtener 133,7 g (95%) de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina en forma de un sólido marrón claro.

50 Los resultados del análisis de RMN fueron como se indican a continuación.

RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7,39-7,60 (m, 3H), 8,59 (d, 1H, J = 2,4 Hz)

La 8-fluoro-3-hidroxiquinolina se produjo según el mismo método. Los resultados del análisis de RMN fueron como se indican a continuación.

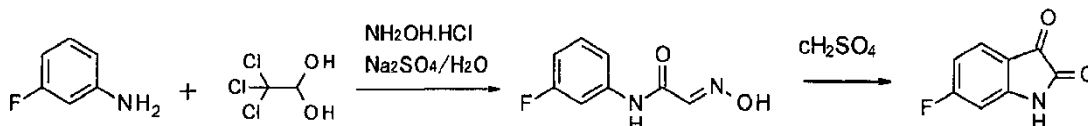
5 RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,16 (m, 1H), 7,34-7,49 (m, 3H), 8,71 (d, 1H,  $J = 2,7$  Hz), 9,90 (bs, 1H)

### Ejemplo 3 de Referencia

Síntesis de 7-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina

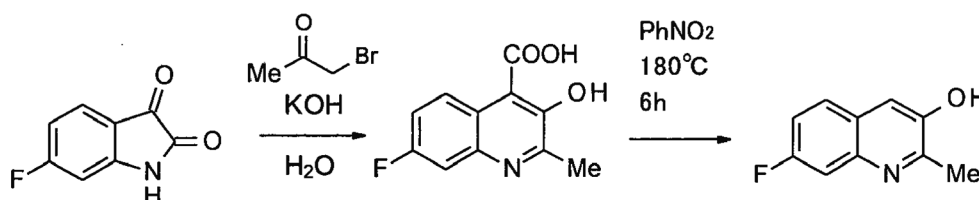
10

Etapa 1) Síntesis de 6-fluoroisatina



15 Se añadieron 9,6 g de 3-fluoroanilina a 590 ml de agua, seguido de la adición de 17,2 g de tricloroacetaldehído monohidratado, 21,9 g de hidrocloreto de hidroxiamina y 98,2 g de sulfato de sodio anhidro y agitación de la mezcla durante 5 horas a 50°C. Después de enfriar el resultante hasta la temperatura ambiente y dejar reposar toda la noche, se le añadieron 31 ml de HCl 2 N, seguido de agitación de la mezcla durante 30 minutos y después de filtración de los cristales. Tras secar los cristales resultantes, los cristales se añadieron a ácido sulfúrico concentrado calentado hasta 70°C, seguido de agitación de la mezcla durante 1 hora a 80°C hasta 90°C. La mezcla de reacción se vertió sobre hielo, seguido de extracción con acetato de etilo y de lavado con disolución salina saturada. Tras secar la capa orgánica con sulfato de magnesio, el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida para obtener 7,96 g de un producto bruto de 6-fluoroisatina.

25 Etapa 2) Síntesis de 7-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina



30 Se añadieron 7,96 g del producto bruto de 6-fluoroisatina a 55 ml de agua, seguido de la adición de 16,2 g (6 equivalentes) de KOH mientras se enfría con hielo, y de agitación durante 30 minutos. Se gotearon 9,9 g (1,5 equivalentes) de bromoacetofenona en la suspensión resultante mientras se mantiene la temperatura interna de la mezcla de reacción a 20°C hasta 25°C, seguido de agitación adicional toda la noche a temperatura ambiente. Tras neutralizar con ácido clorhídrico concentrado, los cristales precipitados se filtraron y se lavaron con una pequeña cantidad de agua. Tras secar adecuadamente los cristales resultantes, se añadieron poco a poco 70 ml de nitrobenzono calentado a 120°C hasta 130°C, seguido de agitación adicional durante 1 hora a 140°C hasta 150°C. Después de enfriar la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente, los cristales precipitados se lavaron con cloroformo para obtener 5,4 g de 7-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina.

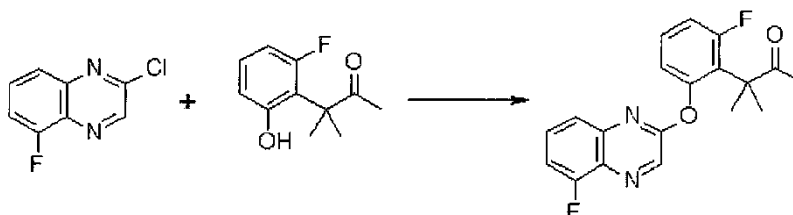
Los resultados del análisis de RMN fueron como se indican a continuación.

40

RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  2,56 (s, 3H), 7,32-7,38 (m, 1H), 7,53-7,57 (m, 1H), 7,80-7,84 (m, 1H)

### Ejemplo 13 de Referencia

45 Síntesis de 3-[2-fluoro-6-(5-fluoro-quinoxalin-2-iloxi)-fenil]-3-metil-butan-2-ona



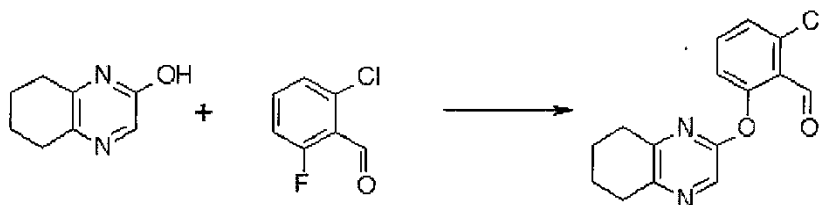
La 2-cloro-5-fluoro-quinoxalina usada como la materia prima se sintetizó según el método descrito en el documento

1 No de patente.

5 Se disolvieron 0,32 g de 3-(2-fluoro-6-hidroxi-fenil)-3-metil-butan-2-ona y 0,28 g de 2-cloro-5-fluoro-quinoxalina en 3 ml de dimetilformamida. Se le añadieron 0,25 g de carbonato de potasio, seguido de agitación durante 2 horas a 100°C. Subsiguientemente, la mezcla de reacción se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,14 g de 3-[2-fluoro-6-(5-fluoro-quinoxalin-2-iloxi)-fenil]-3-metil-butan-2-ona.

#### Ejemplo 14 de Referencia

10 Síntesis de 2-cloro-6-(5,6,7,8-tetrahidroquinoxalin-2-iloxi)-benzaldehído

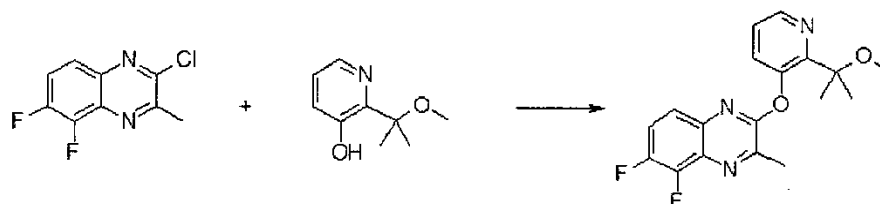


15 La tetrahidroquinoxalona usada como la materia prima se sintetizó según el método descrito en el documento 5 de patente.

20 Se disolvieron 0,3 g de 5,6,7,8-tetrahidroquinoxalin-2-ol en 5 ml de dimetilformamida. Se le añadieron 0,1 g de hidruro de sodio. Se añadieron 0,35 g de 2-cloro-6-fluoro-benzaldehído a la disolución de la reacción, seguido de agitación durante 3 horas a 100°C. Después se añadió ácido clorhídrico 1 N a la disolución de la reacción. Subsiguientemente, la disolución de la reacción se extrajo con acetato de etilo, y la capa orgánica se concentró, seguido de purificación mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,26 g de 2-cloro-6-(5,6,7,8-tetrahidroquinoxalin-2-iloxi)-benzaldehído.

#### Ejemplo 15

25 Síntesis de 5,6-difluoro-2-[2-(1-metoxi-1-metil-etil)-piridin-3-iloxi]-3-metil-quinoxalina



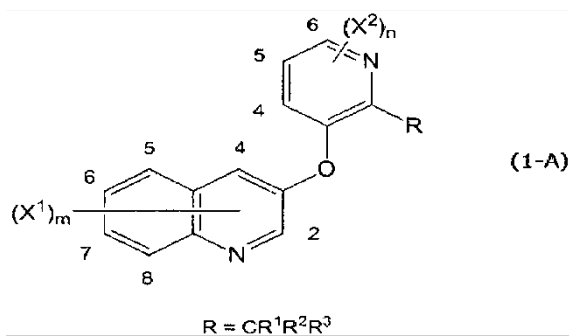
30 Se disolvieron 0,17 g de 2-cloro-5,6-difluoro-3-metilquinoxalina en 2 ml de N-metilpirrolidona. Se le añadieron 0,13 g de 2-(1-metoxi-1-metil-etil)-piridin-3-ol y 0,11 g de carbonato de potasio, seguido de agitación durante 3 horas a 100°C. Subsiguientemente, la disolución de la reacción se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,24 g de 5,6-difluoro-2-[2-(1-metoxi-1-metil-etil)-piridin-3-iloxi]-3-metil-quinoxalina.

35 En las tablas 1 y 2 se muestran compuestos heterocíclicos nitrogenados obtenidos en los ejemplos mencionados anteriormente y compuestos heterocíclicos nitrogenados sintetizados según métodos similares a cualesquiera de los ejemplos mencionados anteriormente.

40 En la tabla 1, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, (X<sup>1</sup>)<sub>m</sub> y (X<sup>2</sup>)<sub>n</sub> representan aquellos grupos mostrados en la fórmula (1-A) (compuestos de referencia).

En la tabla 2, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, (X<sup>1</sup>)<sub>m</sub>, A<sup>1</sup> a A<sup>4</sup> y (X<sup>2</sup>)<sub>n</sub> representan aquellos grupos mostrados en la fórmula (1-B) (compuestos de referencia).

45 Además, el símbolo n<sub>D</sub> mostrado en la columna titulada propiedades físicas indica el índice de refracción (y el número mostrado en superíndice indica la temperatura de medida (°C)).



[Tabla 1]

5

Tabla 1

Compuesto nº	(X¹) <sub>m</sub>	R¹	R²	R³	(X²) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-1	-		≡N		-	149-150
a-2	-	-OH	-CH₃	-CH₃	-	*
a-3	8-F	=O		-H	-	138-140
a-4	2- <sup>t</sup> Bu, 8-F	=O		-H	-	150-151
a-5	8-F	-OH	-H	- <sup>t</sup> Bu	-	110-112
a-6	8-F	=O		- <sup>t</sup> Bu	-	90-91
a-7	2-CH₃, 8-F	-OH	-CH₃	-CH₃	-	*
a-8	8-F	-OH	-CH₃	-CH₃	-	*
a-9	2-CH₃, 8-F	=O		-CH₃	-	133-134
a-10	2-CH₃, 8-F	-OH	-CH₃	- <sup>t</sup> Bu	-	133-136
a-11	8-F	-CH₃	-CH₃	-CN	-	118-120
a-12	8-F	-CH₃	-CH₃	-CO₂Et	-	*
a-13	8-F	-F	-F	-C(CH₃)₂OH	-	
a-14	8-F	-CH₃	-CH₃	-C(CH₃)₂OH	-	105-107
a-15	8-F	-CH₃	-CH₃	-COCH₃	-	146-148
a-16	2-CH₃, 8-F	-OCH₃	-CH₃	-CH₃	-	105-107
a-17	2-CH₃, 8-F	-OCH₂CH=CH₂	-CH₃	-CH₃	-	n <sub>D</sub> <sup>20,6</sup> 1,574

[Tabla 2]

10

Tabla 1 (continuación)

Compuesto nº	(X¹) <sub>m</sub>	R¹	R²	R³	(X²) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-18	2-CH₃, 8-F	-OCH₂Ph	-CH₃	-CH₃	-	n <sub>D</sub> <sup>20,6</sup> 1,594
a-19	8-F	-CH₃	-CH₃	-CO₂H	-	165-167
a-20	8-F	-CH₃	-CH₃	-CON(CH₃)OCH₃	-	*
a-21	8-F	-CH₃	-CH₃	-CHO	-	105-107
a-22	2-CH₃, 8-F	-CH₃	-CH₃	-CO₂Et	-	*
a-23	8-F	-CH₃	-CH₃	-CO₂ <sup>t</sup> Pr	-	93-96
a-24	2-CH₃, 8-F	-CH₃	-CH₃	-CN	-	142-144
a-25	8-F	-CH₃	-CH₃	-CO₂ <sup>-</sup> Na <sup>+</sup>	-	247-249
a-26	7,8-F₂		≡N		-	185-187
a-27	7,8-F₂	=O		-CH₃	-	152-155
a-28	7,8-F₂	-OH	-CH₃	-CH₃	-	100-102
a-29	2-CH₃, 7,8-F₂	-OH	-CH₃	-CH₃	-	144-146
a-30	2-Et, 7,8-F₂	-OCH₃	-CH₃	-CH₃	-	95-97
a-31	7,8-F₂	-OCH₃	-CH₃	-CH₃	-	68-71
a-32	2-CH₃, 7,8-F₂	-OCH₃	-CH₃	-CH₃	-	114-116
a-33	7,8-F₂	-CH₃	-CH₃	-CN	-	*
a-34	2-CH₃, 8-F	-OH	-H	-CH₃	-	99-101
a-35	2-CH₃, 8-F	-OCH₃	-H	-CH₃	-	128-130
a-36	2-CH₃, 8-F	-OCH₂CH=CH₂	-H	-CH₃	-	n <sub>D</sub> <sup>22,4</sup> 1,575

[Tabla 3]

Tabla 1 (continuación)						
Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-37	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-	n <sub>D</sub> <sup>22,4</sup> 1,5648
a-38	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	-CH <sub>3</sub>	-	n <sub>D</sub> <sup>22,6</sup> 1,6084
a-39	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	-CH <sub>3</sub>	1-O <sup>-</sup>	n <sub>D</sub> <sup>20,0</sup> 1,626
a-40	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OH	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	115-116
a-41	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	=N-OCH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	-	108-109
a-42	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OH	-	156-158
a-43	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH(OH)Et	-	*
a-44	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-	*
a-45	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COEt	-	*
a-46	8-F	-CH <sub>3</sub>	-Et	-CN	-	*
a-47	8-F	-CH <sub>3</sub>	-Ph	-CN	-	192-194
a-48	8-F	-CH <sub>3</sub>	-Et	-CO <sub>2</sub> Et	-	*
a-49	8-F	-CH <sub>3</sub>	-Ph	-CO <sub>2</sub> Et	-	n <sub>D</sub> <sup>23,9</sup> 1,5808
a-50	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	101-102
a-51	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	113-115
a-52	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	=N-OEt		-CH <sub>3</sub>	-	112-113
a-53	8-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CONHBn	-	161-163
a-54	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CON(CH <sub>3</sub> )Et	-	120-123
a-55	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CONHEt	-	155-158
a-56	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OEt	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	102-103
a-57	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OEt	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	

[Tabla 4]

5

Tabla 1 (continuación)						
Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-58	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-O <sup>n</sup> Pr	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	
a-59	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-O <sup>n</sup> Pr	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	
a-60	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	
a-61	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>2</sub> (Py-3-il)	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	
a-62	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	
a-63	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	
a-64	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Et	-	
a-65	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr	-	
a-66	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Bu	-	
a-67	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	-	
a-68	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	
a-69	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-	
a-70	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CON(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	
a-71	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CONH <sup>1</sup> Pr	-	
a-72	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO(pirrolidin-1-il)	-	
a-73	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	-	
a-74	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	-	*
a-75	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	*
a-76	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	-	*
a-77	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	-	*
a-78	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	-	*

[Tabla 5]

Tabla 1 (continuación)						
Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-79	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	-	*
a-80	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	=CH <sub>2</sub>		-CH <sub>3</sub>	-	102-103
a-81	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OEt	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	135-136
a-82	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OH	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	157-159
a-83	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	99-100

Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-84	2-CH <sub>3</sub> , 8-Cl	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	131-132
a-85	2-CH <sub>3</sub> , 8-Cl	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	130-131
a-86	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	*
a-87	2,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	101-103
a-88	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OEt	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	*
a-89	2-CH <sub>3</sub> , 8-Cl	=O		-CH <sub>3</sub>	-	159-160
a-90	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	=CHCH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	-	72-74

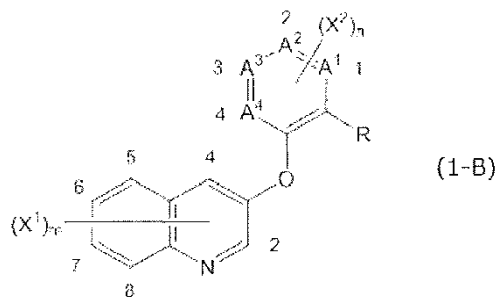
[Tabla 6]

Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-91	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	106-108
a-92	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OEt	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	81-82
a-93	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Et	-	95-96
a-94	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> P	-	n <sub>D</sub> <sup>20,6</sup> 1551
a-95	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr	-	108-110
a-96	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	*
a-97	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pen	-	124-126
a-98	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	-	*
a-99	2-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-	122-124
a-100	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	152-153

5

[Tabla 7]

Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
a-101	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	6-Cl	101-102
a-102	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	103-105
a-103	2-CH <sub>3</sub> , 8-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	6-OCH <sub>3</sub>	129-131
a-104	2-CH <sub>3</sub> , 6-OCH <sub>3</sub>	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-	*



10 [Tabla 8]

Tabla 2

Compuesto n°	(x <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup> , A <sup>2</sup> , A <sup>3</sup> , A <sup>4</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
b-1	-	-F	-F	-F	C, C, C, N	-	*
b-2	-	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C, C, C, N	-	146-147
b-3	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	=O		-OEt	C, C, C, N	-	119-121
b-4	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C, C, C, N	-	140-142
b-5	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C, C, C, N	-	*
c-1	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OH	-CH <sub>3</sub>	-Et	C, C, N, C	1-Cl	105-107

15 Los espectros de RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ se midieron para compuestos indicados en las tablas mencionadas anteriormente que tienen un asterisco en la columna de propiedades físicas. A continuación se muestra una parte de

los resultados de las medidas.

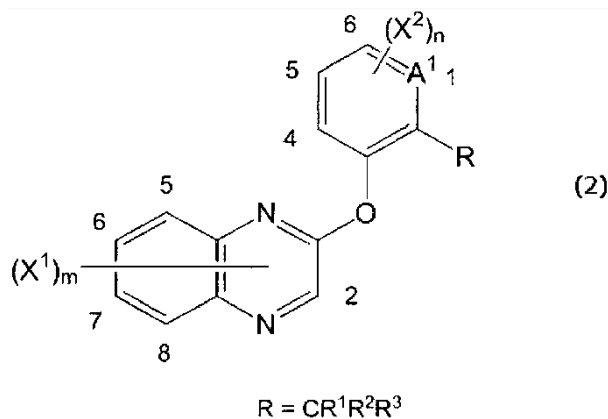
	Compuesto a-2: 1,67 (s,6H), 6,00 (s, 1H), 7,54-7,61 (m,2H), 7,66-7,74 (m,2H), 8,14 (d,1H), 8,38 (t,1H), 8,80 (d,1H)
5	Compuesto a-7: 1,66 (s,6H), 2,81 (s,3H), 6,02 (s,1H), 7,19-7,43 (m,6H), 8,40 (d,1H) Compuesto a-8: 1,65 (s,6H), 5,96 (s,1H), 7,25-7,39 (m,3H), 7,48-7,58 (m,3H), 8,41 (m,1H), 8,85 (d,1H) Compuesto a-12: 1,07 (t,3H), 1,66 (s,6H), 3,88 (q,2H), 7,23-7,27 (m,2H), 7,34 (m,1H), 7,46-7,50 (m,2H), 7,58 (m,1H), 8,45 (d,1H), 8,76 (d,1H)
10	Compuesto a-20: 1,65 (s,6H), 2,98 (s,3H), 3,23 (s,3H), 7,17-7,22 (m,2H), 7,34 (m,1H), 7,46-7,52 (m,2H), 7,64 (m,1H), 8,44 (dd,1H), 8,75 (d,1H) Compuesto a-22: 1,05 (t,3H), 1,66 (s,6H), 2,79 (s,3H), 3,80 (q,2H), 7,25-7,35 (m,3H), 7,40-7,50 (m,3H), 8,45 (m,1H)
15	Compuesto a-33: 1,88 (s,6H), 7,10-7,29 (m,2H), 7,40-7,50 (m,2H), 7,70 (m,1H), 8,42 (d,1H), 8,91 (d,1H) Compuesto a-43: 1,08 (t,3H), 1,46-1,65 (m,2H), 3,88 (d,1H), 4,63 (br,1H), 7,20-7,34 (m,3H), 7,48-7,50 (m,3H), 8,39 (m,1H), 8,83 (d,1H) Compuesto a-44: 1,58 (s,6H), 3,17 (s,3H), 3,69 (s,2H), 7,18-7,26 (m,2H), 7,34 (m,1H), 7,44-7,49 (m,3H), 8,48 (m,1H), 8,86 (d,1H)
20	Compuesto a-45: 0,96 (t,3H), 1,59 (s,6H), 2,50 (q,2H), 7,19-7,23 (m,2H), 7,34 (m,1H), 7,48-7,51 (m,2H), 7,57 (m,1H), 8,47 (m,1H), 8,74 (d,1H) Compuesto a-46: 1,07 (t,3H), 1,84 (s,3H), 2,05 (m,1H), 2,38 (m,1H), 7,24-7,40 (m,3H), 7,49-7,51 (m,2H), 7,66 (m,1H), 8,43 (d,1H), 8,85 (d,1H)
25	Compuesto a-48: 0,85 (t,3H), 1,07 (t,3H), 1,61 (s,6H), 2,04-2,26 (m,2H), 3,86 (q,2H), 7,24-7,26 (m,2H), 7,34 (m,1H), 7,48-7,50 (m,2H), 7,58 (m,1H), 8,46 (m,1H), 8,76 (d,1H) Compuesto a-74: 1,09 (d,6H), 1,64 (s,3H), 4,83 (m,1H), 7,19-7,26 (m,2H), 7,43-7,46 (m,2H), 7,59 (s,1H), 8,44 (m,1H), 8,81 (d,1H) Compuesto a-75: 1,67 (s,6H), 3,43 (s,3H), 7,22-7,38 (m,3H), 7,48-7,50 (m,2H), 7,60 (m,1H), 8,45 (m,1H), 8,75 (d,1H)
30	Compuesto a-76: 1,05 (d,6H), 1,66 (s,6H), 2,80 (s,3H), 4,78 (m,1H), 7,20-7,33 (m,3H), 7,38-7,40 (m,3H), 8,44 (m,1H) Compuesto a-77: 1,05 (d,6H), 1,65 (s,6H), 2,80 (s,3H), 4,77 (m,1H), 7,17-7,26 (m,2H), 7,32-7,38 (m,3H), 8,44 (m,1H)
35	Compuesto a-78: -0,07 (s,9H), 1,55 (s,3H), 2,81 (s,3H), 7,20-7,36 (m,6H), 1,668,46 (m,1H) Compuesto a-79: 1,93 (s,3H), 2,77 (s,3H), 6,59 (s,1H), 7,25-7,42 (m,6H), 8,45 (m,1H) Compuesto a-86: 1,75 (s,6H), 2,06 (t,1H), 2,85 (s,3H), 3,93 (d,2H), 7,23-7,33 (m,5H), 8,43 (m,1H) Compuesto a-88: 0,8-0,9 (m,6H), 1,66 (s,3H), 2,0-2,2 (m,2H), 2,84 (s,3H), 3,1-3,4 (m,2H), 7,19-7,33 (m,5H), 8,45 (m,1H)
40	Compuesto a-96: 1,76 (s,6H), 2,10 (t,1H), 2,77 (s,3H), 3,95 (d,2H), 7,18-7,25 (m,3H), 7,5-7,6 (m,2H), 8,39 (m,1H) Compuesto a-98: 1,04 (d,3H), 1,68 (s,6H), 2,79 (s,3H), 3,17 (s,3H), 3,26 (m,2H), 4,90 (m,1H), 7,15-7,23 (m,2H), 7,26-7,40 (m,3H), 7,47 (s,1H), 8,42 (m,1H)
45	Compuesto a-104: 1,68 (s,6H), 2,70 (s,3H), 3,88 (s,3H), 6,06 (bs,1H), 6,91 (d,1H), 7,14-7,34 (m,3H), 7,94 (d,1H), 8,36 (dd, 1H) Compuesto b-1: 7,13(m,1H), 7,54(m,1H), 7,69(m,1H), 7,79(m,1H), 7,96-8,04(m,2H), 8,14(d,1H), 8,25(br,1H), 8,83(d,1H) Compuesto b-5: 1,73 (s,6H), 2,65 (s,3H), 3,30 (s,3H), 7,06 (m,1H), 7,3-7,5 (m,3H), 7,71 (d,1H), 7,91 (dd,1H), 7,98 (m,1H)

En las tablas 3 y 4 se muestran compuestos heterocíclicos nitrogenados obtenidos en los ejemplos mencionados anteriormente y compuestos heterocíclicos nitrogenados sintetizados según métodos similares a cualesquiera de los ejemplos mencionados anteriormente.

En la tabla 3,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $(X^1)_m$ ,  $A^1$  y  $(X^2)_n$  representan aquellos grupos mostrados en la fórmula (2). Los compuestos en los que  $A^1$  representa C son compuestos de referencia.

En la tabla 4,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $(X^1)_m$ , B,  $A^1$  y  $(X^2)_n$  representan aquellos grupos mostrados en la fórmula (3). Los compuestos en los que  $A^1$  y B no representan ambos N son compuestos de referencia.

Además, el símbolo  $n_D$  mostrado en la columna titulada propiedades físicas indica el índice de refracción (y el número mostrado en superíndice indica la temperatura de medida (°C)).



[Tabla 9]

5

Tabla 3

Compuesto nº	$(X^1)_m$	$R^1$	$R^2$	$R^3$	$A^1$	$(X^2)_n$	Propiedades físicas
1-1	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	-	*
1-2	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -OH	C	-	*
1-3	-	=O		-OCH <sub>3</sub>	C	-	105-107
1-4	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	C	1-F	110-112
1-5	-	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	1-F	104-106
1-6	8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	1-F	125-127
1-7	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	1-F	105-107
1-8	8-F	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	C	1-Cl	95-97
1-9	-	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	C	1-Cl	*
1-10	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	C	1-F	115-118
1-11	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	C	1-F	111-113
1-12	7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	1-F	150-152
1-13	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	1-F	144-146
1-14	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	C	1-F	133-135

[Tabla 10]

Tabla 3 (continuación)							
Compuesto nº	$(X^1)_m$	$R^1$	$R^2$	$R^3$	$A^1$	$(X^2)_n$	Propiedades físicas
1-15	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	C	1-F	140-142
1-16	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	F	F	-COCH <sub>3</sub>	N	-	114-116
1-17	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	F	F	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -OH	N	-	*
1-18	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu	C	-	96-98
1-19	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr	C	-	*
1-20	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CN	N	-	125-127
1-21	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Et	N	-	69-73
1-22	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pen	C	-	99-101
1-23	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr	C	-	109-109
1-24	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr	C	-	*
1-25	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr	C	-	136-138
1-26	8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	88-90
1-27	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	110-112
1-28	7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	111-112
1-29	8-F	-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	75-78
1-30	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	121-123
1-31	7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	100-102
1-32	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	1-O <sup>-</sup>	187-189
1-33	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-O <sup>t</sup> Pr	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	*

10



[Tabla 11]

Tabla 3 (continuación)							
Compuesto nº	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
1-34	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	C	1-F	*
1-35	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	161-163
1-36	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	48-50
1-37	8-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	109-111
1-38	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	72-74
1-39	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	-	123-125
1-40	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Et	N	-	139-142
1-41	7,8-F <sub>2</sub>	-Et	-CH <sub>3</sub>	-CN	N	-	140-141
1-42	7,8-F <sub>2</sub>	-Et	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	*
1-43	7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-Et	-Et	N	-	110-112
1-44	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-Et	-Et	N	-	155-157
1-45	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	N	-	108-110
1-46	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	58-61
1-47	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Et	N	-	105-106
1-48	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	109-113
1-49	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	- <sup>n</sup> Pr	N	-	115-116
1-50	2-CH <sub>3</sub> , 8-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Et	N	-	110-111
1-51	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OEt	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	116-118
1-52	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	107-109

[Tabla 12]

5

Tabla 3 (continuación)							
Compuesto nº	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
1-53	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	111-113
1-54	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	N	-	94-96
1-55	7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	N	-	68-70
1-56	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	99-101
1-57	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CON(CH <sub>3</sub> ) <sup>n</sup> Bu	N	-	n <sub>D</sub> <sup>23,8</sup> 1,553
1-58	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CON(Et) <sup>n</sup> Bu	N	-	n <sub>D</sub> <sup>23,5</sup> 1,547
1-59	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	- <sup>n</sup> Pr	N	-	n <sub>D</sub> <sup>23,2</sup> 1,566
1-60	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	105-106
1-61	2,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	84-86
1-62	2,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	-	98-100
1-63	2-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	110-112
1-64	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-OEt	N	-	89-91
1-65	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	N	-	39-41
1-66	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )Et	N	-	75-77
1-67	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pen	N	-	75-77
1-68	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	N	-	*
1-69	7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> (Tetrahydro-furan-3-il)	N	-	*
1-70	7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	61-63

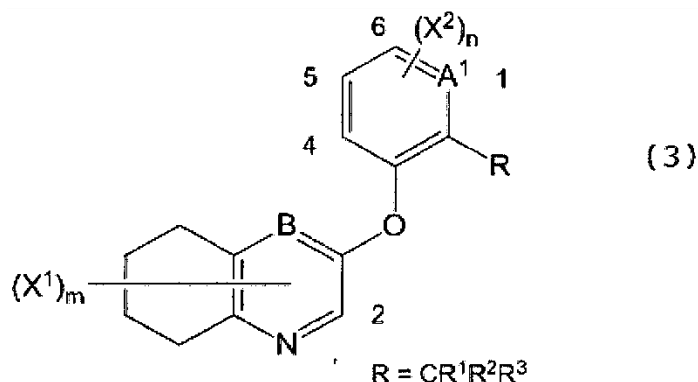
[Tabla 13]

Tabla 3 (continuación)							
Compuesto nº	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
1-71	2-CH <sub>3</sub> , 8-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-OEt	N	-	167-169
1-72	-	-OH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pen	N	-	114-116

Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
1-73	2-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pen	N	-	151-153
1-74	7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pen	N	-	80-82
1-75	2-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	158-160
1-76	2-CH <sub>3</sub> , 8-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-OEt	N	-	114-116
1-77	2-CH <sub>3</sub> , 8-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	117-119
1-78	2-SCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	-	155-157
1-79	2-CH <sub>3</sub> , 7-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CN	N	-	114-115
1-80	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CN	N	-	145-147

[Tabla 14]

Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
1-81	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	=O		-OCH <sub>3</sub>	C	-	138-140
1-82	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	=O		-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C	-	152-153
1-83	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	≡N			C	-	158-161
1-84	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-Et	-CH <sub>3</sub>	-CN	N	-	129-132
1-85	2-CH <sub>3</sub> , 7,8-F <sub>2</sub>	-Et	-CH <sub>3</sub>	-CN	N	-	143-145



5

[Tabla 15]

Tabla 4

10

Compuesto n°	(X <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	B	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
2-1	-	=O		-H	N	C	1-Cl	107-109
2-2	-	-OH	-H	-CH <sub>3</sub>	N	C	1-Cl	91-93
2-3	-	=O		-H	N	C	1-F	106-108
2-4	-	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	N	-	*
2-5	-	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	N	-	
2-6	-	≡N			C	N	-	114-116
2-7	-	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	N	-	74-75
2-8	-	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	C	-	
2-9	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	C	C	-	
2-10	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	C	N	-	
2-11	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	C	-	
2-12	-	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> <sup>1</sup> Pr	N	N	-	

Los espectros de RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ se midieron para compuestos indicados en las tablas mencionadas anteriormente que tienen un asterisco en la columna de propiedades físicas. A continuación se muestra una parte de los resultados de las medidas.

15

Compuesto 1-1: 1,41 (s,9H), 7,13 (d, 1H), 4,22-7,28 (m,2H), 7,49 (m, 1H), 7,59-7,69 (m,2H), 7,80 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,67 (s, 1H)

Compuesto 1-2: 1,22 (s, 6H), 1,50 (s, 6H), 1,97 (s, 1H), 7,09 (m, 1H), 7,23-7,33 (m,2H), 7,57-7,68 (m,3H), 7,77 (m, 1H), 8,07 (m, 1H), 8,67 (s, 1H)

20

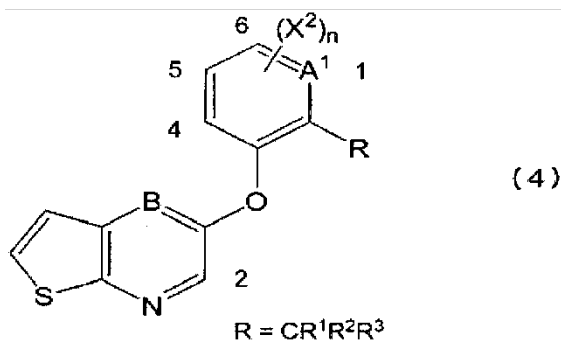
Compuesto 1-9: 1,58 (d,3H), 3,00 (s,3H), 4,95 (q, 1H), 7,13 (m, 1H), 7,28-7,37 (m,3H), 7,57-7,71 (m,3H), 8,07 (m, 1H), 8,72 (s, 1H)

- Compuesto 1-17: 1,40 (s, 6H), 2,89 (s, 3H), 5,26 (s, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,48-7,61 (m,2H), 7,86 (m, 1H), 8,55 (d, 1H)  
 Compuesto 1-19: 1,05 (d,6H), 1,54 (s,6H), 4,75 (m, 1H), 7,28-7,36 (m,4H), 7,50 (d, 1H), 7,58-7,59 (m,2H), 8,65 (s, 1H)  
 5 Compuesto 1-24: 1,05 (d,6H), 1,52 (s,6H), 4,74 (m, 1H), 7,26-7,36 (m,3H), 7,48-7,56 (m,3H), 8,66 (s, 1H)  
 Compuesto 1-33: 0,38 (t, 3H), 0,73 (m, 2H), 1,69 (s, 6H), 2,93 (s,3H), 2,98 (t,2H), 7,27 (m, 1H), 7,35-7,49 (m,3H), 7,63 (d, 1H), 8,51 (d, 1H)  
 Compuesto 1-34: 1,12 (d,6H), 1,59 (s,6H), 4,86 (m, 1H), 6,97-7,05 (m,2H), 7,25-7,36 (m,2H), 7,56-7,63 (m,2H), 8,65 (s, 1H)  
 10 Compuesto 1-42: 0,77 (t,3H), 1,03 (d,6H), 1,51 (s,3H), 2,11 (q, 2H), 4,77 (m, 1H), 7,33 (dd, 1H), 7,50-7,58 (m,2H), 7,73 (dd, 1H), 8,52 (dd, 1H), 8,70 (s, 1H)  
 Compuesto 1-68: 1,05 (d,3H), 1,59 (s,6H), 3,19 (s,3H), 3,21-3,30 (m,2H), 4,95 (m, 1H), 7,33 (dd, 1H), 7,54-7,58 (m,2H), 7,78 (dd, 1H), 8,51 (dd, 1H), 8,74 (s, 1H)  
 15 Compuesto 1-69: 1,58 (s,6H), 1,75-1,92 (m,2H), 3,58-3,70 (m,4H), 4,93 (m, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,54-7,59 (m,2H), 7,72 (dd, 1H), 8,52 (dd, 1H), 8,72 (s, 1H)  
 Compuesto 2-4: 1,68 (s,6H), 1,76-1,82 (m,2H), 1,86-1,92 (m,2H), 2,73 (t,2H), 2,89 (t,2H), 3,14 (s,3H), 6,98 (d, 1H), 7,15-7,16 (m,2H), 8,09 (d, 1H), 8,35 (d, 1H)

20 En las tablas 5 y 6 se muestran compuestos heterocíclicos nitrogenados sintetizados según métodos similares a cualesquiera de los ejemplos mencionados anteriormente.

En la tabla 5, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, B, A<sup>1</sup> y (X<sup>2</sup>)<sub>n</sub> representan aquellos grupos mostrados en la fórmula (4) (compuestos de referencia).

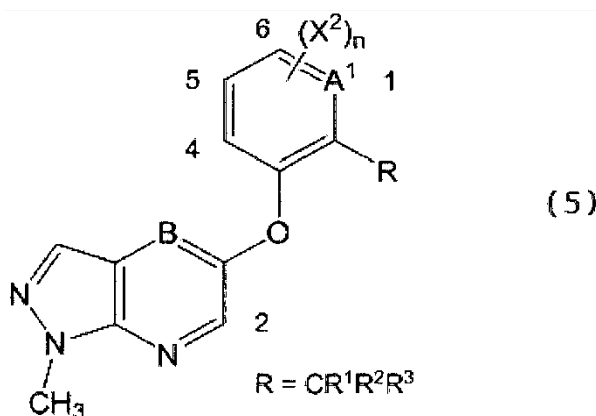
25 En la 6, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, B, A<sup>1</sup> y (X<sup>2</sup>)<sub>n</sub> representan aquellos grupos mostrados en la fórmula (5) (compuestos de referencia).



30 [Tabla 16]

Tabla 5

Compuesto n°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	B	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
3-1	=O		-H	N	C	1-Cl	
3-2	-OH	-H	-CH <sub>3</sub>	N	C	1-Cl	
3-3	=O		-H	N	C	1-F	
3-4	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	N	-	101-103
3-5		≡N		C	N	-	171-172
3-6	=O		-CH <sub>3</sub>	C	N	-	94-96
3-7	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	N	-	
3-8	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	C	-	
3-9	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	C	C	-	
3-10	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	C	N	-	
3-11	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	N	C	-	
3-12	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	N	N	-	



[Tabla 17]

5

Tabla 6

Compuesto nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	B	A <sup>1</sup>	(X <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Propiedades físicas
4-1	=O		-H	N	C	1-Cl	
4-2	-OH	-H	-CH <sub>3</sub>	N	C	1-Cl	
4-3	=O		-H	N	C	1-F	
4-4	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	C	N	-	
4-5	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	N	-	
4-6	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	N	C	-	
4-7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	C	C	-	
4-8	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	C	N	-	
4-9	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	N	C	-	
4-10	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> Pr	N	N	-	

(Preparaciones)

10 Aunque lo siguiente indica ejemplos de fungicidas agrícolas u hortícolas según la presente invención, los aditivos usados y las relaciones en las que se añaden no están limitados a aquellos mostrados en los ejemplos, sino más bien se pueden variar a lo largo de un amplio intervalo. Además, el término "partes" en los ejemplos de preparación indica partes en peso.

15 **Ejemplo 1 de Preparación Polvo humectable**

Compuesto de la presente invención	40 partes
Arcilla	48 partes
Dioctilsulfosuccinato de sodio	4 partes
Lignosulfonato de sodio	8 partes

Los componentes anteriores se mezclaron uniformemente y se pulverizaron finamente para obtener un polvo humectable que contiene 40% del principio activo.

20

**Ejemplo 2 de Preparación Emulsión**

Compuesto de la presente invención	10 partes
Solvesso 200	53 partes
Ciclohexanona	26 partes
Dodecibencenosulfonato de calcio	1 parte
Polioxietilen alquil aril éter	10 partes

Los componentes anteriores se mezclaron y se disolvieron para obtener una emulsión que contiene 10% del principio activo.

25

**Ejemplo 3 de Preparación Polvo**

Compuesto de la presente invención	10 partes
Arcilla	90 partes

Los componentes anteriores se mezclaron uniformemente y se pulverizaron finamente para obtener un polvo que contiene 10% del principio activo.

#### Ejemplo 4 de Preparación Gránulos

5

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

Los componentes anteriores se pulverizaron y mezclaron bien seguido de la adición de agua, mezclando bien, granulando y secando para obtener gránulos que contienen 5% del principio activo.

#### 10 Ejemplo 5 de Preparación Suspensión

Compuesto de la presente invención	10 partes
Polioxietilen alquil aril éter	4 partes
Policarbonato de sodio	2 partes
Glicerina	10 partes
Goma de xantana	0,2 partes
Agua	73,8 partes

Los componentes anteriores se mezclaron seguido de la pulverización en húmedo hasta un tamaño de partículas de 3 micrómetros o menos para obtener una suspensión que contiene 10% del principio activo.

15

#### Ejemplo 6 de Preparación Gránulos humectables

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

Los componentes anteriores se mezclaron uniformemente y se pulverizaron finamente seguido de la adición de una cantidad adecuada de agua y del amasado para formar una mezcla similar a una arcilla. La mezcla similar a una arcilla se granuló y se secó para obtener gránulos humectables que contienen 40% del principio activo.

20

#### (Ejemplo 1-1 de Ensayo Biológico) Ensayo de control de la sarna del manzano

25 Se pulverizaron emulsiones de compuestos de la presente invención a una concentración de principio activo de 100 ppm sobre plantones de manzano (variedad: Ralls Janet, etapa de hoja: 3 a 4) cultivados en macetas sin esmaltar, y se dejaron secar al aire a temperatura ambiente. Subsiguientemente, los plantones se inocularon con conidiosporas del patógeno de la sarna del manzano (*Venturia inaequalis*) seguido del mantenimiento durante 2 semanas en el interior a 20°C y humedad elevada usando un ciclo de luz/oscuridad de 12 horas. El aspecto de las lesiones en las  
30 hojas se comparó con plantones no tratados, para determinar los efectos de control.

Los ensayos de control de la sarna del manzano se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-2, a-3, a-4, a-5, a-6, a-7, a-8, a-9, a-10, a-11, a-12, a-14, a-15, a-16, a-17, a-18, a-19, a-20, a-21, a-22, a-23, a-27, a-28, a-29, a-30, a-31, a-32, a-33, a-34, a-35, a-36, a-37, a-38, a-39, a-40, a-41, a-42, a-43, a-44, a-45, a-46, a-47, a-48, a-49, a-50, a-51, a-52, a-53, a-54, a-55, a-56, a-74, a-75, a-76, a-77, a-78, a-79, a-80, a-81, a-82, a-83, a-84, a-85, a-86, a-87, a-88, a-89, a-90, a-91, a-92, a-93, a-94, a-95, a-96, b-2 y c-1. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

35

Los ensayos de control de la sarna del manzano se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-1, 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-70 y 2-2. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

40

#### 45 (Ejemplo 1-2 de Ensayo Biológico) Ensayo de control de la sarna del manzano

Se pulverizaron emulsiones de compuestos de la presente invención a una concentración de principio activo de 125 ppm sobre plantones de manzano (variedad: Ralls Janet, etapa de hoja: 3 a 4) cultivados en macetas sin esmaltar, y

se dejaron secar al aire a temperatura ambiente. Subsiguientemente, los plantones se inocularon con conidiosporas del patógeno de la sarna del manzano (*Venturia inaequalis*) seguido del mantenimiento durante 2 semanas en el interior a 20°C y humedad elevada usando un ciclo de luz/oscuridad de 12 horas. El aspecto de las lesiones en las hojas se comparó con plantones no tratados, para determinar los efectos de control.

5 Los ensayos de control de la sarna del manzano se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-97, a-98, a-99 y a-100. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

10 Los ensayos de control de la sarna del manzano se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-69, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-79 y 1-80. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

**(Ejemplo 2 de Ensayo Biológico) Ensayo de control del moho gris del pepino**

15 Se pulverizaron emulsiones de compuestos de la presente invención a una concentración de principio activo de 100 ppm sobre plantones de pepino (variedad: Sagami Hanjiro, etapa de hoja: cotiledón) cultivados en macetas sin esmaltar, y se dejaron secar al aire a temperatura ambiente. Subsiguientemente, los plantones se inocularon por goteo con suspensiones de conidiosporas del patógeno del moho gris del pepino (*Botrytis cinerea*) seguido del mantenimiento durante 4 días en una habitación oscura a 20°C y humedad elevada. El aspecto de las lesiones en las hojas se comparó con plantones no tratados, para determinar los efectos de control.

20 Los ensayos de control del moho gris del pepino se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-2, a-5, a-6, a-7, a-8, a-10, a-11, a-12, a-14, a-15, a-16, a-17, a-18, a-20, a-21, a-22, a-23, a-24, a-28, a-29, a-30, a-31, a-32, a-33, a-36, a-37, a-38, a-40, a-42, a-43, a-45, a-46, a-48, a-49, a-50, a-51, a-54, a-56, a-74, a-75, a-76, a-77, a-78, a-79, a-80, a-81, a-82, a-83, a-84, a-85, a-86, a-87, a-88, a-90, a-91, a-92, a-93, a-94, a-95, a-96, a-97, a-98, a-99, a-100, a-101, a-102, b-5 y c-1. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

25 Los ensayos de control del moho gris del pepino se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-33, 1-34, 1-35, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-79, 1-80, 1-81, 1-83, 1-84, 1-85, 2-4 y 3-4. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

35 **(Ejemplo 3 de Ensayo Biológico) Ensayo de aplicación sumergida del quemado del arroz (2 días)**

Se cultivaron plantones de arroz (variedad: Koshihikari, etapa de la hoja: 1) en macetas llenas de tierra para macetas comercialmente disponible y se inundaron con agua, y las emulsiones de los compuestos de la presente invención se gotearon sobre la superficie del agua a una concentración de principio activo de 400 ppm. Dos días más tarde, los plantones se inocularon pulverizándolos con suspensiones de conidiosporas del patógeno del quemado del arroz (*Magnaporthe grisea*), manteniéndolos después durante 2 días en una habitación oscura a 25°C y humedad elevada. A continuación, los plantones se conservaron durante 8 días en el interior a 25°C usando un ciclo de luz/oscuridad de 12 horas. La aparición de lesiones en las hojas se comparó con plantones no tratados, y los efectos de control se evaluaron en base a los criterios indicados a continuación.

- A: Valor de control de 60% o más
- B: Valor de control de 40% a menos de 60%

50 Los ensayos de aplicación a la tierra del quemado del arroz se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-6, a-38, a-46, a-54, a-92, a-95 y b-1. Como resultado, los efectos de control de los compuestos n<sup>os</sup> a-6, a-38, a-46, a-54 y a-92 se evaluaron como A. Los efectos de control de los compuestos n<sup>os</sup> a-95 y b-1 se evaluaron como B.

55 Los ensayos de aplicación sumergida del quemado del arroz se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-20, 1-24, 1-35, 1-57 y 1-68. Como resultado, los efectos de control de los compuestos n<sup>os</sup> 1-20, 1-35, 1-57 y 1-68 se evaluaron como A. Los efectos de control del compuesto n<sup>o</sup> 1-24 se evaluaron como B.

**(Ejemplo 4 de Ensayo Biológico) Ensayo de aplicación sumergida del quemado del arroz (14 días)**

60 Se cultivaron plantones de arroz (variedad: Koshihikari, etapa de la hoja: 1) en macetas llenas de tierra para macetas comercialmente disponible y se inundaron con agua, y las emulsiones de los compuestos de la presente invención se gotearon sobre la superficie del agua a una concentración de principio activo de 400 ppm. 14 días más tarde, los plantones se inocularon pulverizándolos con suspensiones de conidiosporas del patógeno del quemado del arroz (*Magnaporthe grisea*), manteniéndolos después durante 2 días en una habitación oscura a 25°C y humedad elevada, y conservándolos después durante 8 días en el interior a 25°C usando un ciclo de luz/oscuridad de 12 horas. La aparición de lesiones en las hojas se comparó con plantones no tratados, y los efectos de control se

evaluaron sobre la base de los criterios indicados a continuación.

A: Valor de control de 60% o más

5 B: Valor de control de 40% a menos de 60%

Los ensayos de aplicación sumergida del quemado del arroz se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-6, a-8, a-12, a-15, a-16, a-23, a-56, a-74, a-86, a-92 y a-94. Como resultado, los efectos de control de los compuestos n<sup>os</sup> a-6, a-12, a-15, a-16, a-23, a-56, a-74, a-86, a-92 y a-94 se evaluaron como A. Los efectos de control del compuesto n<sup>o</sup> a-8 se evaluaron como B.

Los ensayos de aplicación sumergida del quemado del arroz se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-10, 1-11, 1-14, 1-15, 1-26, 1-27, 1-29, 1-30, 1-31, 1-35, 1-51 y 1-70. Como resultado, los efectos de control de todos los compuestos se evaluaron como A.

15 **(Ejemplo 5 de Ensayo Biológico) Ensayo de tratamiento de semillas de la podredumbre del tallo del pepino**

Semillas de pepino (variedad: Sagami Hanjiro) infectadas con el patógeno de la podredumbre del tallo del pepino (*Fusarium oxysporum*) se trataron con emulsiones de compuestos de la presente invención que tienen una concentración de principio activo de 1 g/kg de semillas. Las semillas se sembraron entonces, y el grado de comienzo de la enfermedad se comparó 3 semanas más tarde con semillas no tratadas, para determinar los efectos de control.

Los ensayos del tratamiento de semillas sobre semillas infectadas con podredumbre del tallo del pepino se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-6, a-7, a-8, a-16, a-38, a-45, a-46, a-54, a-86, a-92 y a-95. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

Los ensayos del tratamiento de semillas sobre semillas infectadas con podredumbre del tallo del pepino se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-14, 1-15, 1-20, 1-24, 1-30, 1-35, 1-38, 1-57, 1-64, 1-68 y 1-79. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

30 **(Ejemplo 6 de Ensayo Biológico) Ensayo de tratamiento de semillas de pepino en tierra infectada con podredumbre del tallo del pepino**

Semillas de pepino (variedad: Sagami Hanjiro) se trataron con emulsiones de compuestos de la presente invención que tienen una concentración de principio activo de 1 g/kg de semillas. Las semillas se sembraron en tierra infectada con el patógeno de la podredumbre del tallo del pepino (*Fusarium oxysporum*), y el grado de comienzo de la enfermedad se comparó 3 semanas más tarde con semillas no tratadas, para determinar los efectos de control.

Los ensayos del tratamiento de semillas en tierra infectada con podredumbre del tallo del pepino se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> a-7, a-16, a-38, a-45, a-46, a-54, a-86 y a-92. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

Los ensayos del tratamiento de semillas en tierra infectada con podredumbre del tallo del pepino se llevaron a cabo en los compuestos n<sup>os</sup> 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-14, 1-15, 1-20, 1-24, 1-30, 1-35, 1-57, 1-64 y 1-68. Como resultado, todos los compuestos demostraron valores de control de 75% o más.

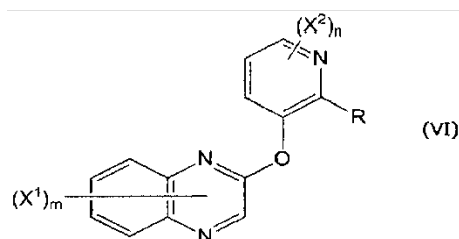
**Aplicabilidad industrial**

50 El compuesto heterocíclico nitrogenado de la presente invención es un compuesto nuevo que es útil como principio activo de un fungicida agrícola u hortícola.

El fungicida agrícola u hortícola de la presente invención es un agente químico seguro que tiene efectos de control fiables y excelentes, no provoca daño químico a las plantas, y tiene poca toxicidad para los seres humanos, ganado o peces, y tiene poco efecto sobre el medio ambiente.

## REIVINDICACIONES

1. Compuesto heterocíclico nitrogenado representado mediante la fórmula (VI), o una sal del mismo:



5

en el que

R representa un grupo representado por  $CR^1R^2R^3$  o un grupo ciano;

10

$R^1$  a  $R^3$  representan respectiva e independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-8 no sustituido, un grupo cicloalquilalquilo de C1-8, un grupo cicloalquenilalquilo de C1-8, un grupo haloalquilo de C1-8, un grupo aril-alquilo de C1-8, un grupo heteroaril-alquilo de C1-8, un grupo hidroxil-alquilo de C1-8, un grupo alcoxi-alquilo de C1-8, un grupo aciloxi-alquilo de C1-8, un grupo trialquilsililoxi-alquilo de C1-8, un grupo arilsulfoniloxi-alquilo de C1-8, un grupo ciano-alquilo de C1-8, un grupo acil-alquilo de C1-8, un grupo 2-hidroxiimino-alquilo de C1-8, un grupo carboxi-alquilo de C1-8, un grupo alcocarbonil-alquilo de C1-8, un grupo azido-alquilo de C1-8, un grupo alquenilo de C2-8 no sustituido, un grupo alquinilo de C2-8 no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido, un grupo cicloalquenilo de C4-8 no sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido, un grupo acilo de C1-8 no sustituido, un grupo (1-imino)alquilo de C1-8 no sustituido, un grupo carboxilo no sustituido, un grupo alcocarbonilo, un grupo carbamoilo no sustituido, un grupo monoalquilcarbamoilo, un grupo dialquilcarbamoilo, un grupo monoarilcarbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi, un grupo cicloalquilalcoxi, un grupo aralquiloxi, un grupo haloalcoxi, un grupo alqueniloxi, un grupo alquiniloxi, un grupo cicloalquiloxi, un grupo ariloxi, un grupo arilalquiloxi, un grupo aciloxi, un grupo alcocarbonilalquiloxi, un grupo trialquilsililoxi, un grupo amino no sustituido, un grupo mercapto no sustituido, un grupo sulfonilo, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro,

15

20

25

30

con la condición de que  $R^1$  a  $R^3$  no sean todos átomos de hidrógeno,  $R^1$  a  $R^3$  no sean todos grupos alquilo de C1-8 no sustituidos; en un caso cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  es un átomo de hidrógeno, los dos restantes no son grupos alquilo de C1-8 no sustituidos; en un caso cualquiera de  $R^1$  a  $R^3$  es un grupo alquilo de C1-8 no sustituido, los dos restantes no son átomos de hidrógeno,

35

$X^1$  representa respectiva e independientemente un grupo alquilo de C1-8 no sustituido, un grupo alquenilo de C2-8 no sustituido, un grupo alquinilo de C2-8 no sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

m representa un número de  $X^1$ , y es un número entero de 0 a 5;

40

$X^2$  representa respectiva e independientemente un grupo alquilo de C1-8 no sustituido, un grupo alquenilo de C2-8 no sustituido, un grupo alquinilo de C2-8 no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido, un grupo cicloalquenilo de C4-8 no sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido, un grupo heterocíclico no sustituido, un grupo acilo de C1-8 no sustituido, un grupo (1-imino)alquilo de C1-8 no sustituido, un grupo carboxilo no sustituido, un grupo carbamoilo no sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo amino no sustituido, un grupo mercapto no sustituido, un grupo sulfonilo, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

45

n representa un número de  $X^2$ , y es un número entero de 0 a 3.

50

2. Fungicida agrícola u hortícola que comprende como principio activo del mismo por lo menos un compuesto seleccionado de entre el grupo que consiste en compuestos heterocíclicos nitrogenados o sales de los mismos, según la reivindicación 1.