

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 607 889**

51 Int. Cl.:

C07D 261/04 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **23.09.2013 PCT/EP2013/069737**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.04.2014 WO14048882**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **23.09.2013 E 13766517 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.09.2016 EP 2900644**

54 Título: **3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas con actividad herbicida y fungicida**

30 Prioridad:

25.09.2012 EP 12185767

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

04.04.2017

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**HAAF, KLAUS BERNHARD;
WILLMS, LOTHAR;
DIETRICH, HANSJÖRG;
GATZWEILER, ELMAR;
ROSINGER, CHRISTOPHER HUGH;
SCHMUTZLER, DIRK;
WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE;
GROSJEAN-COURNOYER, MARIE-CLAIRE;
LACHAISE, HELENE;
RINOLFI, PHILIPPE y
BRUNET, STEPHANE**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones:

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

ES 2 607 889 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

3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas con actividad herbicida y fungicida

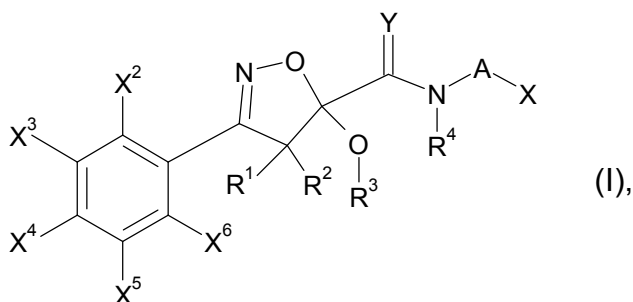
5 La invención se refiere al campo técnico de los herbicidas y fungicidas, especialmente al de los herbicidas para el combate selectivo de malezas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles.

Específicamente se refiere a 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas, a procedimientos para su preparación y a su uso como herbicidas y fungicidas.

10 Por los documentos DE 4026018 A1, EP 0 520 371 A2 y DE 4017665 se conocen 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas que portan un átomo de hidrógeno en la posición 5 del anillo de isoxazolina. Estos compuestos se describen allí como protectores con actividad agroquímica, es decir como compuestos que eliminan la acción herbicida no deseada de los herbicidas en las plantas de cultivo. Ninguna acción herbicida de estos compuestos se desvela. La solicitud de patente europea n.º 10170238, que tiene una fecha de prioridad anterior, no publicada previamente, desvela 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas con actividad herbicida y fungicida que portan un átomo de hidrógeno en la posición 5 del anillo de isoxazolina. Por Monatshefte Chemie (2010) 141, 461 y Letters in Organic Chemistry (2010), 7, 502 también se conocen 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas que portan un átomo de hidrógeno en la posición 5 del anillo de isoxazolina. Para algunos de los compuestos mencionados se desvela una actividad fungicida, pero no herbicida.

Es un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos con actividad herbicida y fungicida.

20 Se ha hallado que las 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas son particularmente adecuadas como herbicidas y fungicidas. La presente invención tiene como un objeto 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas de fórmula (I) o sus sales



en la que

25 R¹ y R² significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o significan alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo y ciano

o

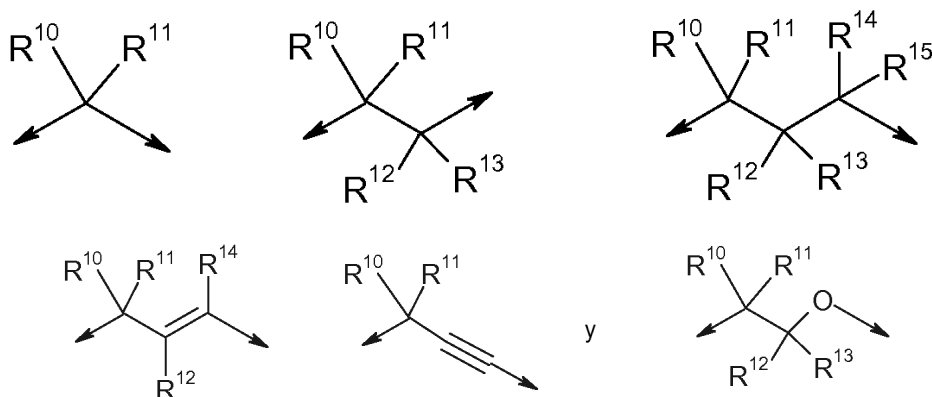
30 R¹ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de tres, cuatro o cinco miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que está formado por q átomos de carbono y p átomos de oxígeno;

R³ significa alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alcoxi (C₁-C₄) e hidroxilo;

R⁴ significa hidrógeno, ciano

35 o alquilo (C₁-C₈), cicloalquilo (C₃-C₈), alqueno (C₃-C₈) o alquino (C₃-C₈) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo y alcoxi (C₁-C₆),

A significa un enlace o una unidad divalente del grupo que consiste en



R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ y R¹⁵ significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, R⁵,

5 o alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₅), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,

o alcoxi (C₁-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), alqueniloxi (C₂-C₆) o alquiniloxi (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

Y significa oxígeno o azufre;

10 X significa hidrógeno, ciano, hidroxilo, X¹

o

15 alquilo (C₁-C₁₂), cicloalquilo (C₃-C₈), alquenilo (C₂-C₁₂) o alquinilo (C₂-C₁₂) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, OR⁷, X¹, OX¹, NHX¹, S(O)_nR⁵, SO₂NR⁶R⁷, SO₂NR⁶COR⁸, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, COR⁶, CONR⁶SO₂R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶COR⁸, NR⁶CONR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, NR⁶SO₂R⁸, NR⁶SO₂NR⁶R⁸, OCONR⁶R⁸, OCSNR⁶R⁸, POR⁹R⁹ y C(R⁶)=NOR⁸

o

20 X, A y R⁴ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que contiene, además de este átomo de nitrógeno, k átomos de carbono, n átomos de oxígeno, p átomos de azufre y p elementos del grupo que consiste en NR⁷ y NCOR⁷ como átomos del anillo, donde un átomo de carbono porta p grupos oxo;

X¹ significa un anillo de tres, cuatro, cinco o seis miembros saturado, parcialmente insaturado, totalmente insaturado o aromático que está formado por r átomos de carbono, s átomos de nitrógeno, n átomos de azufre y n átomos de oxígeno, y que está sustituido con s restos del grupo que consiste en R⁶, R^{6a}, R⁸ y R⁹, donde los átomos de azufre y los átomos de carbono portan n grupos oxo;

25 o X¹ significa fenilo sustituido con m restos del grupo que consiste en R⁶, R^{6a}, R⁸ y R⁹;

X², X⁴ y X⁶ significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro,

o alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₅), alquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alcoxi (C₁-C₄), alqueniloxi (C₂-C₄), alquiniloxi (C₂-C₄) o alquilcarbonilo (C₁-C₄) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C₁-C₄);

30 X³ y X⁵ significan independientemente entre sí hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, nitro, SF₅, CONR⁶SO₂R⁵, CONR⁶R⁸, COR⁶, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, C(R⁶)=NOR⁸, NR⁶COR⁸, NR⁶CONR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, NR⁶SO₂R⁸, NR⁶SO₂NR⁶R⁸, OCONR⁶R⁸, OSO₂R⁵, S(O)_nR⁵, SO₂NR⁶R⁸, OSO₂NR⁶R⁸,

o alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₅), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,

35 o alcoxi (C₁-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), alqueniloxi (C₂-C₆) o alquiniloxi (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

R⁵ significa alquilo (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano e hidroxilo;

R⁶ significa hidrógeno o R⁵;

R^{6a} significa flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, S(O)_nR⁵ o alcoxi (C₁-C₆), alquenioloxi (C₃-C₆) o alquinioloxi (C₃-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

5 R⁷ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alqueniolo (C₂-C₄) o alquiniolo (C₂-C₄) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

R⁸ significa R⁷,

R⁹ significa alquilo (C₁-C₃) o alcoxi (C₁-C₃),

k significa 3, 4, 5 o 6;

10 m significa 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

n significa 0, 1 o 2;

p significa 0 o 1;

q significa 3, 4 o 5;

r significa 1, 2, 3, 4 o 5;

15 s significa 0, 1, 2, 3 o 4.

Alquilo significa restos hidrocarbilo de cadena lineal o ramificados saturados, con el número de átomos de carbono especificado en cada caso, por ejemplo, alquilo C₁-C₆, tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

Alquilo sustituido con halógeno significa grupos alquilo de cadena lineal o ramificados donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar sustituidos con átomos de halógeno, por ejemplo, haloalquilo C₁-C₂, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo.

Alqueniolo significa restos hidrocarbilo de cadena lineal o ramificados insaturados con el número de átomos de carbono especificado en cada caso y un enlace doble en una posición discrecional, por ejemplo alqueniolo C₂-C₆, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

Alquiniolo significa restos hidrocarbilo de cadena lineal o ramificados con el número de átomos de carbono especificado en cada caso y un enlace triple en una posición discrecional, por ejemplo alquiniolo C₂-C₆, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo (o propargilo), 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 3-metil-1-butinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 3-metil-1-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 1-metil-2-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo.

Alcoxi significa restos alcoxi de cadena lineal o ramificados saturados con el número de átomos de carbono especificado en cada caso, por ejemplo alcoxi C₁-C₆, tales como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-

etilpropoxi, hexoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi. Alcoxi sustituido con halógeno significa restos alcoxi de cadena lineal o ramificados con el número de átomos de carbono especificado en cada caso, donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar sustituidos por átomos de halógeno según se especificó anteriormente, por ejemplo haloalcoxi C₁-C₂, tales como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-1,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi.

De acuerdo con la naturaleza de los sustituyentes y la forma en la que están unidos, los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes como estereoisómeros. Si, por ejemplo, uno o más átomos de carbono sustituidos asimétricamente y/o sulfóxidos están presentes, pueden surgir enantiómeros o diastereómeros. Los estereoisómeros se pueden obtener a partir de las mezclas obtenidas en la preparación mediante procedimientos de separación habituales, por ejemplo por procedimientos de separación cromatográfica. De igual modo es posible preparar de forma selectiva estereoisómeros usando reacciones estereoselectivas con uso de materiales de partida y/o coadyuvantes con actividad óptica. La invención además se refiere a todos los estereoisómeros y mezclas de los mismos que estén comprendidos por la fórmula (I) pero no se definen específicamente. Con la intención de simplificar, sin embargo, en lo sucesivo se hace siempre referencia a compuestos de fórmula (I), aunque esto signifique tanto los compuestos puros como dado el caso mezclas con diferentes proporciones de compuestos isoméricos.

De acuerdo con la naturaleza de los sustituyentes definidos anteriormente, los compuestos de fórmula (I) tienen propiedades ácidas y pueden formar sales, dado el caso también sales internas o productos de adición con bases inorgánicas u orgánicas o con iones metálicos. Si los compuestos de fórmula (I) portan hidroxilo, carboxilo u otros grupos que inducen propiedades ácidas, estos compuestos se pueden hacer reaccionar con bases para dar sales. Las bases adecuadas son, por ejemplo, hidróxidos, carbonatos, hidrogenocarbonatos de los metales alcalinos y alcalinotérreos, especialmente los de sodio, potasio, magnesio y calcio, además amoníaco, aminas primarias, secundarias y terciarias con grupos alquilo (C₁-C₄), mono-, di- y trialcanolaminas de alcoholes (C₁-C₄), colina y clorocolina.

Si un grupo está polisustituido con restos, esto significa que este grupo está sustituido con uno o más restos idénticos o diferentes de los restos mencionados.

En todas las fórmulas especificadas en adelante, los sustituyentes y los símbolos tienen la misma definición que la descrita en la fórmula (I), a menos que se defina de forma diferente. Las flechas en una fórmula química indican los puntos de enlace al resto de la molécula.

Se da preferencia a 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas de fórmula (I), en la que

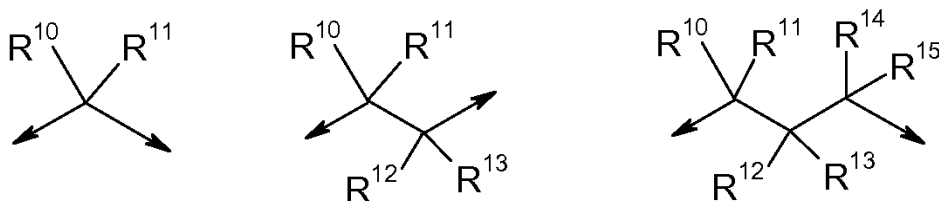
R¹ y R² significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo y ciano

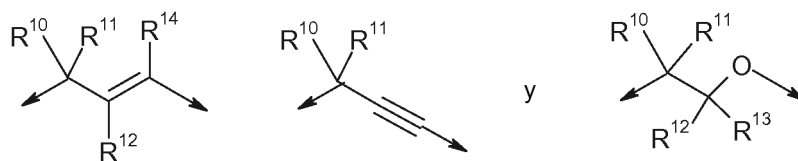
o
R¹ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de tres, cuatro o cinco miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que está formado por q átomos de carbono y p átomos de oxígeno;

R³ significa alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alcoxi (C₁-C₄) e hidroxilo,

R⁴ significa hidrógeno, ciano o alquilo (C₁-C₈) o cicloalquilo (C₃-C₈) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo y alcoxi (C₁-C₆);

A significa un enlace o una unidad divalente del grupo que consiste en





5 R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, R^5 , o alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₅), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano o alcoxi (C₁-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), alquenoiloxi (C₂-C₆) o alquinoiloxi (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

Y significa oxígeno o azufre;

X significa hidrógeno, ciano, hidroxilo, X¹

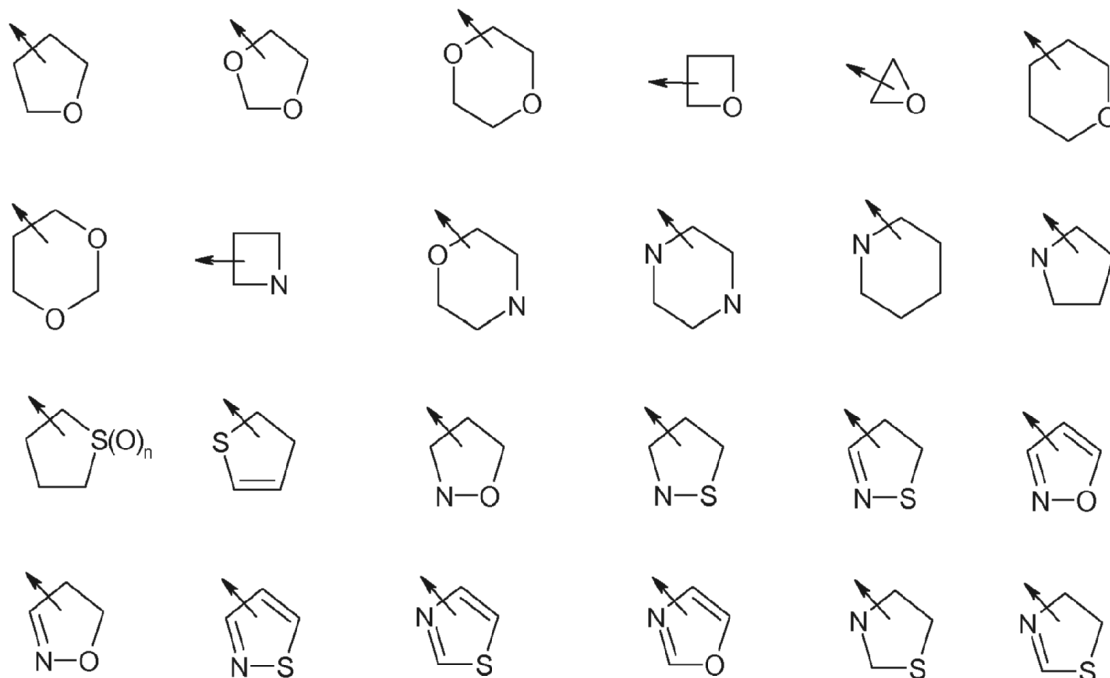
o

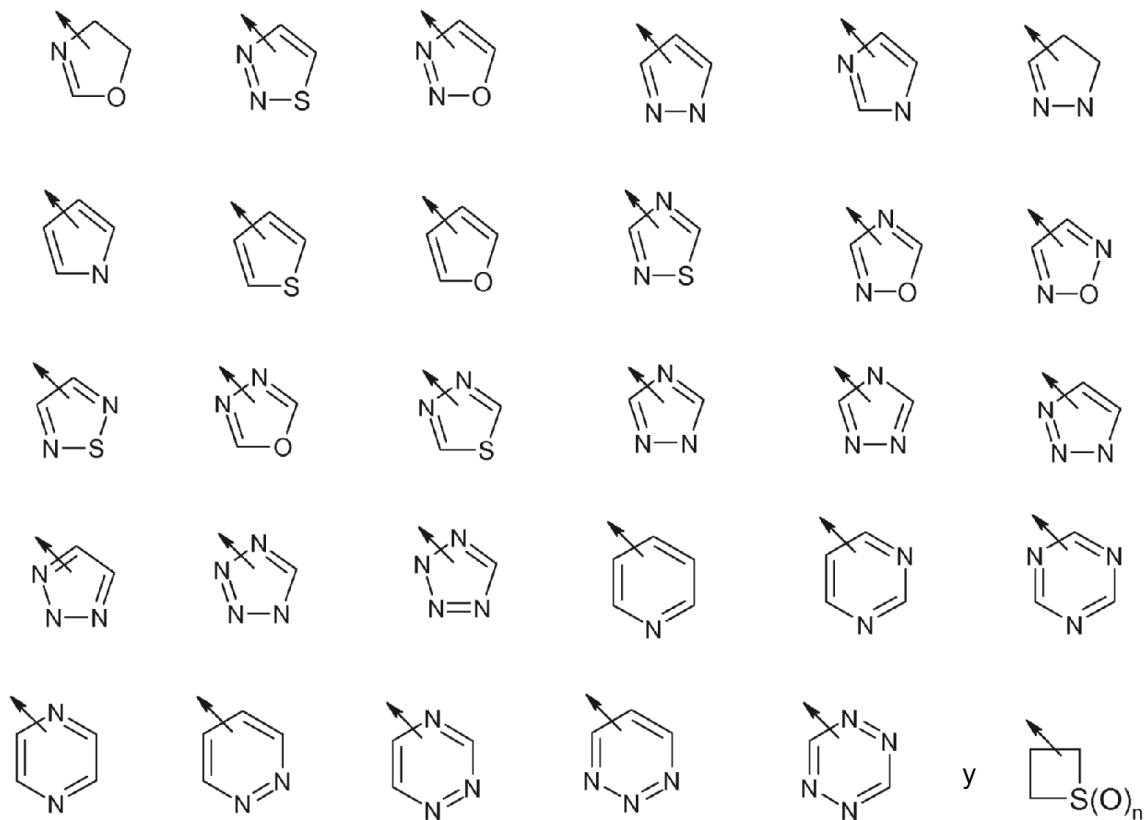
10 alquilo (C₁-C₁₂), cicloalquilo (C₃-C₈), alqueno (C₂-C₁₂) o alquino (C₂-C₁₂) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, OR⁷, X¹, OX¹, NHX¹, S(O)_nR⁵, SO₂NR⁶R⁷, SO₂NCOR⁶R⁸, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, COR⁶, CONR⁸SO₂R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶COR⁸, NR⁶CONR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, NR⁶SO₂R⁸, NR⁶SO₂NR⁶R⁸, OCONR⁶R⁸, OCSNR⁶R⁸, POR⁹R⁹ y C(R⁶)=NOR⁸

o

15 X, A y R⁴ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que contiene, además de este átomo de nitrógeno, k átomos de carbono, n átomos de oxígeno, p átomos de azufre y p elementos del grupo que consiste en NR⁷ y NCOR⁷ como átomos del anillo, donde un átomo de carbono porta p grupos oxo;

X¹ significa un anillo sustituido con s restos del grupo que consiste en R⁶, R^{6a}, R⁸ y R⁹ del grupo que consiste en





o X^1 significa fenilo sustituido con m restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 ;

X^2 , X^4 y X^6 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro,

5 o alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_4), alquino (C_2-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenoiloxi (C_2-C_4), alquinoiloxi (C_2-C_4) o alquilcarbonilo (C_1-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C_1-C_4);

X^3 y X^5 significan independientemente entre sí hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, nitro, SF_5 , $CONR^8SO_2R^5$, $CONR^6R^8$, COR^6 , CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, $C(R^6)=NOR^8$, NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$, $NR^6CO_2R^8$, $NR^6SO_2R^8$, $NR^6SO_2NR^6R^8$, $OCOR^6R^8$, OSO_2R^5 , $S(O)_nR^5$, $SO_2NR^6R^8$, $OSO_2NR^6R^8$,

10 o alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,

o alcoxi (C_1-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_6), alquenoiloxi (C_2-C_6) o alquinoiloxi (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

15 R^5 significa alquilo (C_1-C_6) o cicloalquilo (C_3-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano e hidroxilo;

R^6 significa hidrógeno o R^5 ;

R^{6a} significa flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, $S(O)_nR^5$ o alcoxi (C_1-C_6), alquenoiloxi (C_2-C_6) o alquinoiloxi (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

20 R^7 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_4) o alquino (C_2-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

R^8 significa R^7 ,

R^9 significa alquilo (C_1-C_3) o alcoxi (C_1-C_3),

k significa 3, 4, 5 o 6;

25 m significa 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

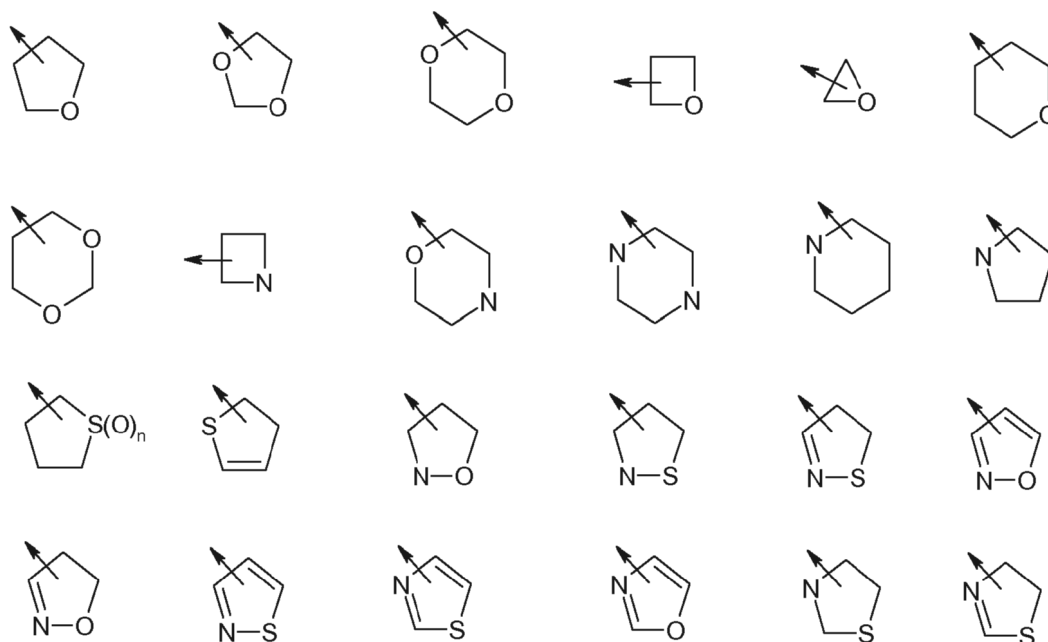
n significa 0, 1 o 2;

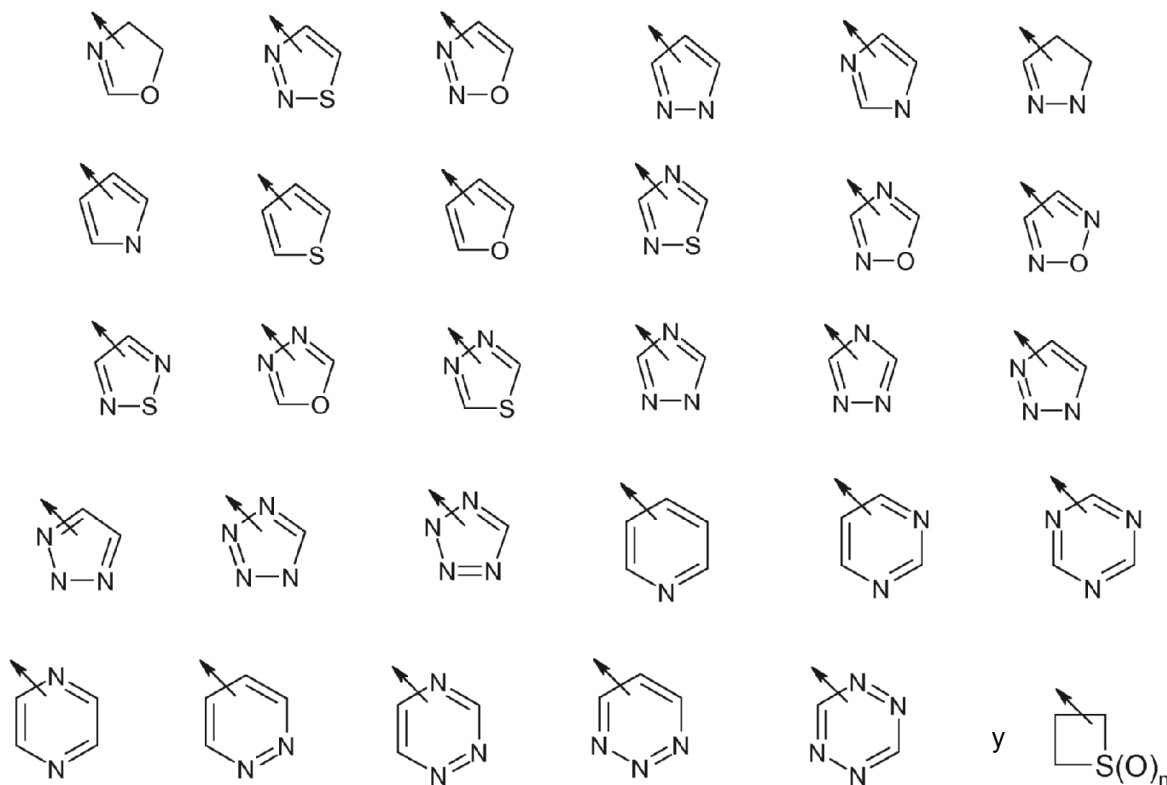
p significa 0 o 1;

q significa 3, 4 o 5;

s significa 0, 1, 2, 3 o 4.

- 5 Se da particular preferencia a 3-fenilisoxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas de fórmula (I), en la que
 R^1 y R^2 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o significan alquilo (C_1-C_4) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo y ciano,
 R^3 significa alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_4), alquenilo (C_2-C_3) o alquinilo (C_2-C_3) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano, alcoxi (C_1-C_2),
 10 A significa un enlace o una unidad divalente del grupo que consiste en CH_2 , CH_2CH_2 , $CHCH_3$, $CH_2CH_2CH_2$, $CH(CH_2CH_3)$, $CH(CH_3)CH_2$, $C(CH_3)_2$, $C(CH_3)_2CH_2$, $C(iPr)CH_3$, $CH(CH_2iPr)CH_2$, $CH_2CH=CH$, $C(CH_3)_2C=C$, $CH(CF_3)CH_2$, $CH(CH_3)CH_2O$, CH_2CH_2O , $CH(CPr)CH_2O$, $CH(CH_2OCH_3)$, $CH(CH_2CH_2SCH_3)$, $CH(COOH)$, $CH(COOCH_3)$, $CH(COOH)CH_2$, $CH(COOCH_3)CH_2$, $CH_2COH(CF_3)$, $CH(CONHCH_3)$, $CH(CONHCH_3)CH_2$ y
 15 $CH_2CH_2CONHCH_2$;
 R^4 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_8),
 Y significa oxígeno o azufre;
 X significa hidrógeno, ciano, hidroxilo, X^1
 o
 20 alquilo (C_1-C_{12}), cicloalquilo (C_3-C_8), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, ciano, hidroxilo, OR^7 , X^1 , OX^1 , NHX^1 , $S(O)_nR^5$, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, $CONR^8SO_2R^5$ y POR^9R^9 ;
 X^1 significa un anillo sustituido con s restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 del grupo que consiste en





o X^1 significa fenilo sustituido con m restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 ;
 X^2 , X^4 y X^6 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor o cloro
 o alquilo (C_1-C_4) o significan alcoxi (C_1-C_4) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor,
 5 cloro, ciano y alcoxi (C_1-C_4),

X^3 y X^5 significan independientemente entre sí hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano
 o significan alquilo (C_1-C_6) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor y cloro
 o alcoxi (C_1-C_6) sustituido con m restos del grupo que consiste en flúor y cloro;

R^5 significa metilo o etilo;

10 R^6 significa hidrógeno o R^5 ;

R^{6a} significa flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, $S(O)_nR^5$ o alcoxi (C_1-C_6), alquenciloxi (C_2-C_6) o alquiniiloxi (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

R^7 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_6) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor y cloro,
 R^8 significa R^7 ,

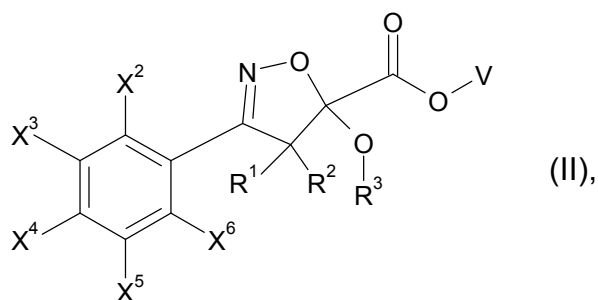
15 R^9 significa alcoxi (C_1-C_3),

m significa 0, 1, 2 o 3;

n significa 0, 1 o 2;

s significa 0, 1, 2, 3 o 4.

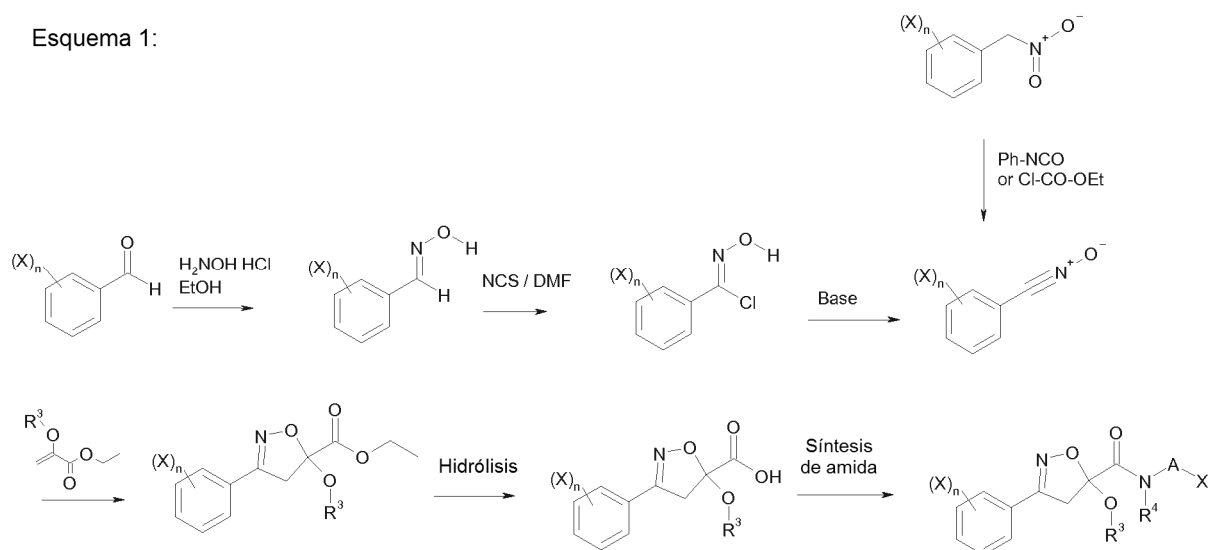
20 Son intermedios adecuados para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) los compuestos de fórmula (II):



en la que los restos X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , R^1 , R^2 , R^3 y R^5 tienen el significado descrito en la fórmula (I) y V se refiere a hidrógeno o R^5 . Los compuestos de fórmula (II) son nuevos y de igual modo son objeto de la presente invención.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden preparar de acuerdo con reacciones conocidas per se por el experto en la materia, por ejemplo de acuerdo con la secuencia de reacción especificada en el esquema 1.

Esquema 1:

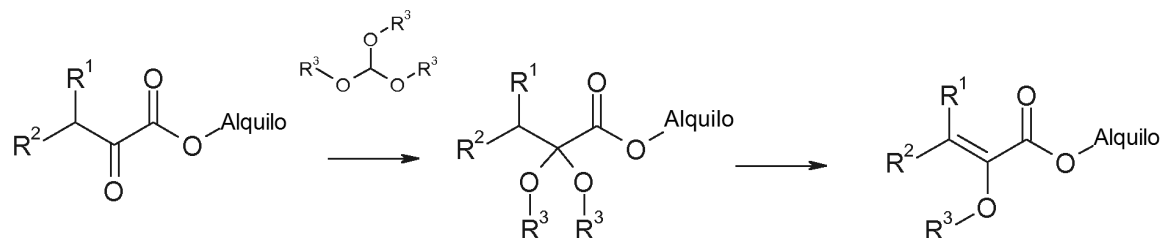


En el esquema 1 y en los esquemas que siguen, (X)_n significa los sustituyentes X², X³, X⁴, X⁵ y X⁶. Estas cicloadiciones 1,3-dipolares de óxidos de nitrilo con dipolarófilos adecuados se describen, por ejemplo, en las recapitulaciones: 1,3 dipolar Cycloaddition Chemistry, Padwa, ed. Wiley, Nueva York, 1984; Kanemasa y Tsuge, Heterocycles 1990, 30, 719. Para la preparación de cloroximas, véase Kim, Jae N., Ryu, Eung K. J. Org. Chem. 1992, 57, 6649).

Los compuestos de acuerdo con la invención sustituidos en las posiciones 4 y 5 del sistema de anillo de isoxazolina se pueden preparar de igual modo mediante cicloadición 1,3-dipolar usando olefinas 1,2-disustituidas de forma adecuada como dipolarófilos. Usualmente, esta reacción da mezclas de diastereómeros que pueden ser separados por cromatografía en columna. Las isoxazolininas ópticamente activas se pueden obtener por HPLC quiral de precursores adecuados o productos finales, y de igual modo por reacciones enantioselectivas, como por ejemplo escisión enzimática de éster o amida o usando reactivos auxiliares quirales sobre el dipolarófilo, como se describe por Olssen (J. Org. Chem. 1988, 53, 2468).

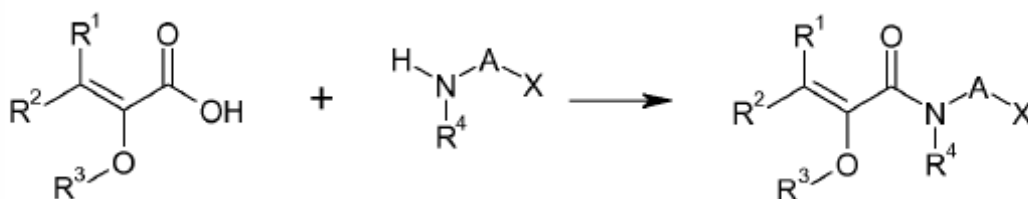
La preparación de ésteres de ácidos 2-alcoxiacrílicos sustituidos de forma adecuada (esquema 2) es posible, por ejemplo, por conversión de alfa-cetoésteres en los correspondientes cetales (bib.: Wenkert, E; Alonso, M. E.; Buckwalter B. L., Sanchez E. L. J. Am. Chem. Soc. 1983, 105, 2021 y bib.: LaMattina, J. L.; Mularski, C. J., J. Org. Chem. 1984, 49, 4800) y la eliminación de los mismos para dar ésteres de ácidos 2-alcoxiacrílicos (de forma análoga ib.: Esswein A. y col., Helvetica Chimica Acta 1989, 72 (2), 213.)

Esquema 2:



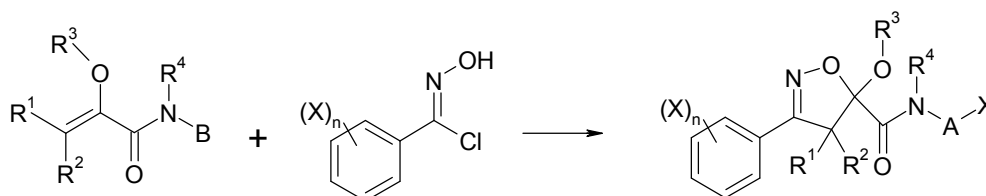
Para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención es posible además usar amidas de ácido 2-alcoxiacrílico sustituidas de forma adecuada (esquema 3). Estas se pueden obtener de los ésteres de ácidos acrílicos descritos en el esquema 2 después de la hidrólisis y formación de amida.

Esquema 3:



5 Para la activación del ácido alcoxiacrílico, a este respecto las carbodiimidias tales como las EDCI, por ejemplo, son una opción (Chen, F. M. F.; Benoiton, N. L. *Synthesis* 1979, 709). Para la preparación de amidas de ácido acrílico véanse los documentos US2521902, JP60112746, *J. of Polymer Science* 1979, 17 (6), 1655. Las amidas de ácido 2-alcoxiacrílico sustituidas de forma adecuada se pueden convertir en una reacción de 1,3-cicloaddición con óxidos de nitrilo en los compuestos de acuerdo con la invención (esquema 4).

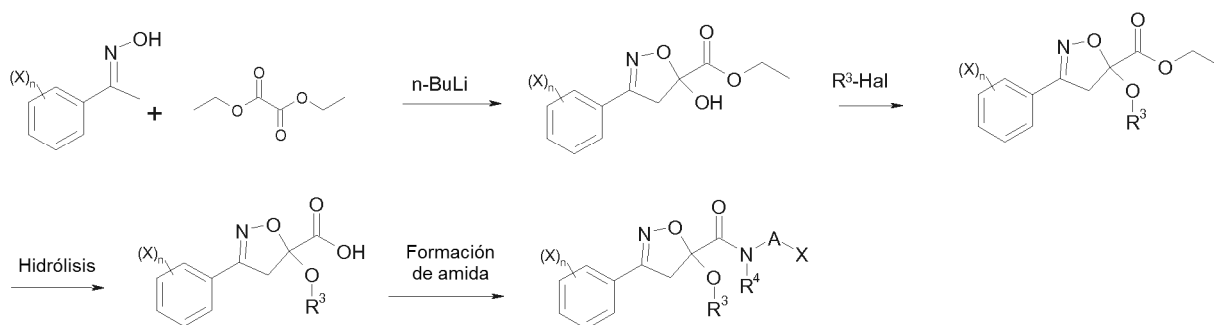
Esquema 4:



10 Las transformaciones de los grupos funcionales R³ son posibles o bien en la etapa de alquenos o en la etapa de isoxazolininas.

El esquema 5 describe la vía a distintas isoxazolininas R³-sustituidas.

Esquema 5



15 La reacción de diésteres de ácidos oxálicos con oximas (esquema 5) conduce a 5-hidroxi-3-fenilisoxazolininas (bib.: Dang, T. T., Albrecht U., Langer P., *Synthesis* 2006, 15, 2515). El grupo hidroxilo entonces puede derivatizarse en condiciones adecuadas. Los compuestos objetivo se pueden obtener a partir de los ésteres después de la hidrólisis y posterior formación de amida.

El esquema 6 describe la ruta a 5-alcoxi-3-fenil-isoxazolin-5-tioamidas por conversión de las 5-alcoxi-3-fenil-isoxazolin-5-carboxamidas usando el reactivo de Lawesson (bib.: WYETH, documento WO2003/93277, bib.: Wishka D. G., Walker D. P., *Tetrahedron Letters* 2011, 52, 4713-4715).

Esquema 6



Las colecciones de compuestos de fórmula (I) y/o sus sales, que se pueden sintetizar mediante las reacciones antes mencionadas, también se pueden preparar en paralelo, en cuyo caso esto se puede llevar a cabo de forma manual, parcialmente automatizada o totalmente automatizada. Es posible, por ejemplo, automatizar la conducción de la reacción, el procesamiento o la purificación de los productos y/o intermedios. En suma, esto se entiende que significa una forma de proceder como el descrito, por ejemplo, por D. Tiebes en *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor Günther Jung), Wiley, 1999, en las páginas 1 a 34.

Para la conducción en paralelo de la reacción y el procesamiento, es posible usar una serie de instrumentos disponibles en el comercio, por ejemplo bloques de reacción Calpyso (Caylps reaction blocks) de la empresa Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EE.UU o las estaciones de reacción (reaction stations) de la empresa Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, Inglaterra, o las estaciones de trabajo automatizadas MultiPROBE de la empresa PerkinElmer, Waltham, Massachusetts 02451, EE.UU. Para la purificación en paralelo de los compuestos de fórmula (I) y sus sales o de los intermedios que surgen en el curso de la preparación están disponibles entre otros aparatos de cromatografía, por ejemplo, de la empresa ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

Los aparatos detallados conducen a una forma de proceder modular en la que las etapas de trabajo individuales son automáticas, pero deben ser llevadas a cabo operaciones manuales entre las etapas de trabajo. Esto se puede sortear mediante el uso de sistemas de automatización parcial o totalmente integrados en los que los módulos de automatización respectivos son operados, por ejemplo, por robots. Los sistemas de automatización de este tipo se pueden adquirir, por ejemplo, en la empresa Caliper, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

La realización de las etapas de síntesis simples o múltiples se puede apoyar mediante el uso de reactivos soportados por polímeros/resinas depuradoras. La bibliografía especializada describe una serie de protocolos experimentales, por ejemplo en *ChemFiles*, Vol. 4, n.º 1, *Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis* (Sigma-Aldrich).

Aparte de los procedimientos descritos aquí, los compuestos de fórmula (I) y sus sales se pueden preparar de forma completa o parcial mediante procedimientos respaldados por fase sólida. A este fin, los intermedios individuales o todos los intermedios en la síntesis o una síntesis adaptada para la correspondiente forma de proceder se unen a una resina de síntesis. Los procedimientos de síntesis respaldados por fase sólida se describen de forma exhaustiva en la bibliografía técnica, por ejemplo Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998 y *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor Günther Jung), editorial Wiley, 1999. El uso de procedimientos de síntesis respaldados por fase sólida permite una serie de protocolos conocidos en la bibliografía, y estos nuevamente se pueden ejecutar de forma manual o de manera automatizada. Las reacciones se pueden realizar, por ejemplo, mediante la tecnología IRORI en microrreactores (microreactors) de la empresa Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EE.UU.

O bien sobre una fase sólida o en la fase líquida, la realización de etapas de síntesis simples o múltiples pueden estar apoyadas por el uso de la tecnología de microondas. La bibliografía técnica describe un número de protocolos experimentales, por ejemplo en *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry* (editores C. O. Kappe y A. Stadler), editorial Wiley, 2005.

La preparación de acuerdo con los procedimientos descritos aquí da los compuestos de fórmula (I) y sus sales en la forma de colecciones de sustancias, que se denominan bibliotecas. La presente invención además tiene por objeto bibliotecas que contienen al menos dos compuestos de fórmula (I) y sus sales.

Los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) (y/o sus sales), que se denominan de forma colectiva en adelante "compuestos de acuerdo con la invención", tienen excelente eficacia herbicida contra un amplio espectro de plantas dañinas anuales mono- y dicotiledóneas importantes desde el punto de vista económico. Los principios activos además tienen buen control sobre plantas dañinas perennes que son difíciles de combatir que brotan de los rizomas, cepas y otros órganos perennes.

Por lo tanto, la presente invención además tiene por objetivo un procedimiento para combatir plantas no deseadas o para regular el crecimiento de plantas, preferentemente en cultivos de plantas en los que uno o más compuestos de acuerdo con la invención se aplican a las plantas (por ejemplo plantas dañinas tales como malezas mono- o dicotiledóneas o plantas de cultivo no deseadas), a las semillas (por ejemplo granos, semillas o propágulos vegetativos tales como tubérculos o partes de brotes con yemas) o al área sobre la que se desarrollan las plantas (por ejemplo el área de cultivo). Los compuestos de acuerdo con la invención a este respecto se pueden emplear, por ejemplo, antes de la siembra (si fuera apropiado además mediante la incorporación en el suelo), antes de la emergencia o después de la emergencia. Ejemplos específicos de algunos representantes de la flora de la maleza mono- y dicotiledónea que se puede combatir mediante los compuestos de acuerdo con la invención son los siguientes, aunque la enumeración no intenta imponer una restricción a especies particulares.

Plantas dañinas monocotiledóneas de los géneros: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium,

Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Malezas dicotiledóneas de los géneros: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cuando los compuestos de acuerdo con la invención se aplican a la superficie del suelo antes de la germinación, o bien se evita completamente que emerjan las plántulas de maleza o las malezas se desarrollan hasta que hayan alcanzado la etapa de cotiledón, pero entonces se detiene el crecimiento y, eventualmente después de transcurridas tres a cuatro semanas, mueren por completo.

Si los principios activos se aplican en el procedimiento de pos-emergencia a las partes verdes de las plantas, el desarrollo se detiene después del tratamiento y las plantas dañinas quedan en la etapa de desarrollo del momento de la aplicación, o mueren completamente después de un cierto tiempo, de modo que la competición de las malezas, que es dañino para las plantas de cultivo, se elimina de este modo muy temprano y de una forma perdurable.

Aunque los compuestos de acuerdo con la invención tienen excelente actividad herbicida contra las malezas mono- y dicotiledóneas, las plantas de cultivo de los cultivos importantes desde el punto de vista económico, por ejemplo cultivos dicotiledóneos de los géneros Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia, o cultivos monocotiledóneos de los géneros Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, especialmente Zea y Triticum, se dañan solo en una medida insignificante, o en absoluto, dependiendo de la estructura del respectivo compuesto de acuerdo con la invención y la dosis de aplicación del mismo. Por estas razones, los presentes compuestos son muy adecuados para el combate selectivo del desarrollo no deseado de la planta en los cultivos de plantas tales como las plantas útiles desde el punto de vista agrícola u ornamentales.

Además, los compuestos de acuerdo con la invención (dependiendo de su estructura particular y la dosis de aplicación aplicada) tienen propiedades reguladoras del desarrollo sobresalientes en las plantas de cultivo. Intervienen para regular el metabolismo de la planta y entonces se pueden usar para influir de manera controlada sobre los constituyentes de la planta y facilitar la cosecha, por ejemplo disparando la desecación y el retraso del crecimiento. Además, son adecuados para el combate general y la inhibición del desarrollo vegetal no deseado sin destruir a este respecto las plantas. La inhibición del desarrollo vegetativo cumple una función importante para muchos cultivos mono- y dicotiledóneos, ya que, por ejemplo se puede reducir o evitar por completo el encamado.

Debido a sus propiedades herbicidas y reguladoras del crecimiento de la planta, los principios activos también se pueden usar para controlar plantas dañinas en cultivos de plantas modificadas genéticamente conocidas o de aquéllas que aún están por desarrollarse. En general, las plantas transgénicas se destacan por las propiedades ventajosas especiales, por ejemplo por resistencias a ciertos plaguicidas, en particular ciertos herbicidas, resistencias a las enfermedades de las plantas u organismos que causan enfermedades de la planta, tales como ciertos insectos o microorganismos, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, calidad, almacenaje, composición y constituyentes específicos. Así, hay plantas transgénicas conocidas con contenido de almidón aumentado o calidad de almidón alterado, o aquéllas con una composición diferente de ácidos grasos del material cosechado. Otras propiedades particulares radican en la tolerancia o resistencia a los factores de estrés abióticos, por ejemplo, calor, frío, sequía, salinidad y radiación ultravioleta.

Se da preferencia al uso de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) o sus sales en los cultivos transgénicos importantes desde el punto de vista económico de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, mijo, arroz, mandioca y maíz, u otros cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisante y otras variedades de hortalizas.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden usar preferentemente como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes, o han sido hechas resistentes por medio de ingeniería genética, a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

Las formas convencionales de producir plantas nuevas que tienen propiedades modificadas en comparación con las plantas que han aparecido hasta la fecha consisten en, por ejemplo, procedimientos de cultivo selectivo tradicionales y la generación de mutantes. Como alternativa, las plantas nuevas con propiedades alteradas se pueden generar con la ayuda de procedimientos de ingeniería genética (véase, por ejemplo, los documentos EP 0221044, EP 0131624). Por ejemplo, ha habido descripciones de varios casos de modificaciones por ingeniería genética de plantas de cultivo a los fines de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo documentos WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A), plantas de cultivo transgénicas resistentes a herbicidas particulares del tipo glufosinato (cf., por ejemplo, con los documentos EP 0242236 A, EP 0242246 A) o glifosato

(documento WO 92/000377A) o sulfonilurea (documentos EP 0257993 A, US 5.013.659) o a combinaciones o mezclas de estos herbicidas a través del "apilamiento génico", tales como plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo maíz o soja con el nombre comercial o la designación Optimum™ GAT™ (tolerante al glifosato ALS),

- 5 - plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, capaces de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt), que hacen a las plantas resistentes a plagas particulares (documentos EP-A-0142924, EP-A-0193259).
- plantas de cultivo transgénicas que tienen una composición de ácidos grasos modificada (documento WO 91/013972 A).
- 10 - plantas de cultivo modificadas por ingeniería genética con nuevos constituyentes o metabolitos secundarios, por ejemplo fitoalexinas nuevas que causan un incremento en la resistencia a la enfermedad (documentos EP 0309862 A, EP 0464461 A)
- plantas modificadas por ingeniería genética con fotorrespiración reducida, que tienen rendimientos más altos y tolerancia al estrés más elevada (documento EP 0305398 A)
- 15 - plantas de cultivo transgénicas que producen proteínas importantes desde el punto de vista farmacéutico o diagnóstico ("*molecular pharming*", "agricultura molecular")
- plantas de cultivo transgénicas que se destacan por rendimientos más elevados o mejor calidad
- plantas de cultivo transgénicas que se destacan por una combinación, por ejemplo, de las propiedades novedosas antes mencionadas ("apilamiento génico").

20 En principio se conocen numerosas técnicas de biología molecular que se pueden usar para producir nuevas plantas transgénicas con propiedades modificadas; véase por ejemplo, I. Potrykus y G. Spangenberg (eds.), *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg o Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

25 Para estas manipulaciones de ingeniería genética se pueden introducir en plásmidos moléculas de ácido nucleico que permitan mutagénesis o un cambio de secuencia por recombinación de las secuencias de ADN. Con la ayuda de procedimientos normalizados es posible, por ejemplo, emprender cambios de bases, eliminar partes de secuencias o adicionar secuencias naturales o sintéticas. Para la conexión de los fragmentos de ADN entre sí es posible añadir adaptadores o engarces a los fragmentos, véase por ejemplo, Sambrook y col., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2ª ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim, 2ª edición, 1996.

30 La producción de células vegetales con una actividad reducida de un producto génico se puede obtener, por ejemplo, por la expresión de al menos un ARN antisentido apropiado, un ARN efector para el logro de un efecto de cosupresión o la expresión de al menos un ribozima construido de forma apropiada que escinde específicamente los transcritos del producto génico antes mencionado. Para este fin, en primer lugar es posible usar moléculas de ADN que comprendan la secuencia codificante completa de un producto génico que incluya cualquier secuencia

35 flaqueante presente, u otras moléculas de ADN que comprendan solo partes de la secuencia codificante, en cuyo caso estas partes deben ser lo suficientemente largas para ocasionar un efecto antisentido en las células. Además es posible usar secuencias de ADN que tengan un alto grado de homología con la secuencias codificantes de un producto génico, pero no sean completamente idénticas.

40 Cuando se expresan moléculas de ácido nucleico en las plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimiento deseado de la célula vegetal. Sin embargo, para obtener la localización en un compartimiento particular, es posible, por ejemplo, conectar la región codificante con las secuencias de ADN que aseguran la localización en un compartimiento particular. Estas secuencias son conocidas por el experto en la materia (véase, por ejemplo, Braun y col., *EMBO J.* 11 (1992), 3219-3227; Wolter y col., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846-850; Sonnewald y col., *Plant J.* 1 (1991), 95-106). Las moléculas de ácido nucleico también se

45 pueden expresar en los orgánulos de las células vegetales.

Las células de plantas transgénicas se pueden regenerar mediante técnicas conocidas para dar plantas enteras. En principio, las plantas transgénicas pueden ser plantas de cualquier especie de planta deseada, es decir tanto plantas monocotiledóneas como dicotiledóneas. De este modo, es posible obtener plantas transgénicas cuyas propiedades son alteradas por sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias génicas homólogos (= naturales), o

50 la expresión de genes o secuencias génicas heterólogos (= extraños).

Los compuestos de acuerdo con la invención (I) se pueden usar con preferencia en cultivos transgénicos que sean resistentes a reguladores del crecimiento, por ejemplo, 2,4-D dicamba, o a herbicidas que inhiben las enzimas de plantas esenciales, por ejemplo, acetolactato sintasas (ALS), EPSP sintasas, glutamina sintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD), o a herbicidas del grupo de las sulfonilureas, los glifosatos, glufosinatos o

55 benzoilisoaxazoles y principios activos análogos, o a cualquier combinación deseada de estos principios activos.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar con particular preferencia en plantas de cultivo transgénicas que sean resistentes a una combinación de glifosatos y glufosinatos, glifosatos y sulfonilureas o imidazolinonas. Más preferentemente, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar en plantas de cultivo transgénicas tales como maíz o soja con el nombre comercial o la designación Optimum™ GAT™

(tolerante al glifosato ALS), por ejemplo.

Un empleo de los principios activos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos no solo produce efectos hacia plantas dañinas observados en otros cultivos, sino a menudo también efectos que son específicos de la aplicación en el cultivo transgénico particular, por ejemplo un espectro de malezas alterado o específicamente ampliado que se puede combatir, dosis de aplicación alteradas que se pueden usar para la aplicación, preferentemente buena capacidad de combinación con herbicidas a los que es resistente el cultivo transgénico, e influencia en el crecimiento y rendimiento de las plantas de cultivo transgénicas.

Por lo tanto, la invención además tiene por objeto el uso de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) y de los compuestos de fórmula (Ia) como herbicidas para combatir plantas dañinas en plantas de cultivo transgénicas.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden aplicar en la forma de polvos humectables, concentrados emulsionables, soluciones pulverizables, agentes de espolvoreo o gránulos en las formulaciones habituales. Por lo tanto, la invención además tiene por objeto agentes herbicidas y que regulan el crecimiento de la planta que comprenden los compuestos de acuerdo con la invención.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden formular en varias formas, de acuerdo con los parámetros biológicos y/o físico-químicos requeridos. Las posibles formulaciones incluyen, por ejemplo: polvos humectables (WP), polvos hidrosolubles (SP), concentrados hidrosolubles, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones de aceite en agua y agua en aceite, soluciones pulverizables, concentrados de suspensión (SC), dispersiones oleosas o acuosas, soluciones miscibles con aceite, suspensiones en cápsulas (CS), agentes de espolvoreo (DP), productos de desinfección de semillas, gránulos para el voleo y aplicación al suelo, gránulos (GR) en la forma microgránulos, gránulos pulverizables, gránulos de revestimiento y gránulos para adsorción, gránulos dispersables en agua (WG), gránulos hidrosolubles (SG), formulaciones ULV, microcápsulas y ceras. Estos tipos de formulación individuales son conocidos en principio y se describen, por ejemplo, en: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volumen 7, C. Hanser Verlag München, 4ª Ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3ª Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

Los coadyuvantes de formulación necesarios, tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos, son conocidos de igual modo y se describen, por ejemplo, en: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª ed., Darland Books, Caldwell N. J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª ed., J. Wiley & Sons, N.Y., C. Marsden, "Solvents Guide", 2ª ed., Interscience, N.Y. 1963, McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J., Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxid-addukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª ed. 1986.

Sobre la base de estas formulaciones además es posible producir combinaciones con otros principios activos, por ejemplo insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, y además con protectores, fertilizantes, y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en la forma de una formulación terminada o como una mezcla de tanque. Los protectores adecuados son, por ejemplo, mefenpir-dietilo, ciprosulfamida, isoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo y diclorimid.

Los polvos humectables son preparaciones que se pueden dispersar de forma uniforme en agua y, además del principio activo, aparte de un diluyente o sustancia inerte, también comprenden tensioactivos del tipo iónico y/o no iónico (agentes humectantes, dispersantes), por ejemplo alquifenoles polioxietilados, alcoholes grasos polioxietilados, aminas grasas polioxietiladas, sulfatos de alcohol graso poliglicol éter, alcanosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, lignosulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato de sodio, dibutilnaftalenosulfonato de sodio o también oleoilmetiltaurinato de sodio. Para preparar los polvos humectables, los principios activos herbicidas se muelen finamente, por ejemplo en un aparato habitual tal como molinos de martillo, molinos de soplado y molinos de chorro de aire, y de forma simultánea o subsiguiente se mezclan con los coadyuvantes de formulación.

Los concentrados emulsionables se producen disolviendo el principio activo en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno u otros compuestos aromáticos de ebullición relativamente alta o hidrocarburos o mezclas de los disolventes orgánicos, con adición de uno o más tensioactivos del tipo iónico y/o no iónico (emulsionantes). Los emulsionantes usados pueden ser, por ejemplo: sales de alquilarilsulfonato de calcio tales como dodecibencenosulfonato de Ca o emulsionantes no iónicos tales como poliglicol ésteres de ácido graso, alquilaril poliglicol ésteres, poliglicol ésteres de alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, alquil poliéteres, ésteres de sorbitán, por ejemplo, ésteres de sorbitán ácido graso o ésteres de sorbitán polioxietileno, por ejemplo ésteres del ácido graso de sorbitán polioxietileno.

Los agentes de espolvoreo se obtienen moliendo el principio activo con sustancias sólidas finamente distribuidas, por ejemplo talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierra de diatomeas.

Los concentrados de suspensión pueden tener base acuosa u oleosa. Se pueden producir, por ejemplo, por molienda húmeda mediante molinos de perlas comerciales con la adición opcional de tensioactivos como los ya

enumerados anteriormente, por ejemplo, para los otros tipos de formulación.

Emulsiones, por ejemplo, emulsiones de aceite en agua (EW), se pueden preparar, por ejemplo, mediante agitadores, molinos coloidales y/o mezcladoras estáticas usando disolventes orgánicos acuosos y opcionalmente tensioactivos como los ya enumerados anteriormente, por ejemplo, para los otros tipos de formulación.

5 Los gránulos se pueden producir o bien pulverizando el principio activo sobre material inerte granulado con capacidad de adsorción o aplicando concentrados de principio activo mediante adhesivos, por ejemplo, poli(alcohol vinílico), poliacrilato de sodio o también aceites minerales, a la superficie de las sustancias vehiculares, tales como arena, caolinitas o de material inerte granulado. Los principios activos adecuados se pueden granular además de la manera habitual para la producción de gránulos de fertilizante, si se desea como una mezcla con fertilizantes.

10 Los gránulos dispersables en agua se producen en general mediante los procedimientos habituales tales como secado por aspersión, granulación por lecho fluidizado, granulación en bandejas, mezclado con mezcladoras de alta velocidad y extrusión sin material inerte sólido.

15 Para la producción de gránulos en bandejas, lecho fluidizado, extrusora y aspersión, véase, por ejemplo, los procedimientos en "Spray-Drying Handbook" 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J. E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y sig.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª ed., McGraw-Hill, Nueva York 1973, págs. 8-57.

Para otros detalles con respecto a la formulación de agentes fitoprotectores véase, por ejemplo, G. C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y J. D. Freyer, S. A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

20 Las preparaciones agroquímicas contienen en general 0,1 hasta 99 % en peso, especialmente 0,1 hasta 95 % en peso, de los compuestos de acuerdo con la invención. En los polvos humectables, la concentración del principio activo es, por ejemplo, aproximadamente 10 hasta 90 % en peso, consistiendo el resto hasta 100 % en peso en componentes de formulación habituales. En los concentrados emulsionables, la concentración de principio activo puede ser de aproximadamente 1 hasta 90, preferentemente 5 hasta 80 % en peso. Las formulaciones tipo polvo
25 contienen 1 hasta 30 % en peso del principio activo, preferentemente la mayoría de las ocasiones 5 hasta 20 % en peso del principio activo, las soluciones pulverizables contienen aproximadamente 0,05 hasta 80 % en peso, preferentemente desde 2 hasta 50 % en peso, del principio activo. En el caso de gránulos dispersables en agua, el contenido de principio activo depende en parte de si el compuesto activo está presente en forma líquida o sólida y de qué coadyuvantes de granulación, cargas, etc., se usan. En los gránulos dispersables en agua, el contenido de
30 principio activo es, por ejemplo, entre 1 y 95 % en peso, preferentemente entre 10 y 80 % en peso.

Además, las formulaciones de principio activo mencionadas comprenden opcionalmente los respectivos agentes de adherencia, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, anticongelantes y disolventes, cargas, vehículos y colorantes, antiespumantes, inhibidores de evaporación y agentes que influyen en el pH y la viscosidad habituales.

35 Sobre la base de estas formulaciones además es posible producir combinaciones con otras sustancias con actividad plaguicida, por ejemplo insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, y con protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en la forma de una formulación terminada o como una mezcla de tanque.

40 Para su aplicación, las formulaciones en forma comercial se diluyen, si fuera apropiado, de manera habitual, por ejemplo en el caso de polvos humectables, concentrados emulsionables, dispersiones y gránulos dispersables en agua con agua. Las formulaciones tipo polvo, gránulos para aplicación al suelo o voleo y soluciones pulverizables no se diluyen normalmente con otras sustancias inertes antes de la aplicación.

La dosis de aplicación requerida de los compuestos de fórmula (I) varía con las condiciones externas, incluyendo la temperatura, humedad y el tipo de herbicida usado. Puede variar dentro de amplios límites, por ejemplo entre 0,001 y 1,0 kg/ha o más de sustancia activa, pero preferentemente está entre 0,005 y 750 g/ha.

45 Además de las propiedades herbicidas, los compuestos de acuerdo con la invención también tienen buenas propiedades fungicidas. De este modo, la presente invención además se refiere a una composición para combatir microorganismos no deseados que comprende los principios activos de acuerdo con la invención. Preferentemente se trata de agentes fungicidas que comprenden coadyuvantes útiles desde el punto de vista agrícola, disolventes, vehículos, tensioactivos o extensores. La invención además se refiere también a un procedimiento para combatir
50 microorganismos no deseados, caracterizado porque se aplican los principios activos de acuerdo con la invención a los hongos fitopatógenos y/o su hábitat. De acuerdo con la invención, un vehículo es una sustancia natural o sintética, orgánica o inorgánica que se mezcla o se combina con los principios activos para una mejor aplicabilidad, en particular para la aplicación a plantas o partes de plantas o semillas. El vehículo, que puede ser sólido o líquido, en general es inerte y debe ser adecuado para su uso en agricultura. Vehículos sólidos o líquidos útiles incluyen: por
55 ejemplo sales de amonio y polvos minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y polvos de minerales sintéticos, tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, especialmente butanol,

disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales, y además sus derivados. Las mezclas de estos vehículos se pueden usar de igual modo. Los vehículos sólidos útiles para gránulos incluyen: por ejemplo rocas molidas y naturales fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y además gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos y además gránulos de material orgánico, tales como el serrín, las cáscaras de coco, mazorcas de maíz y los tallos de tabaco. Los vehículos o extensores gaseosos licuados útiles son aquellos líquidos que son gaseosos a temperatura normal y a presión atmosférica, por ejemplo propulsores de aerosol, tales como los hidrocarburos, y además butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. En las formulaciones, es posible usar agentes de adherencia, tales como carboximetilcelulosa, los polímeros naturales y sintéticos en la forma de polvos, gránulos o látex, tales como la goma arábiga, el poli(alcohol vinílico) y poli(acetato de vinilo), y otros fosfolípidos naturales, tales como las cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales. Si el extensor usado es el agua, además es posible por ejemplo, usar disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Los disolventes líquidos útiles son esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o diclorometano, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como butanol o glicol, y sus ésteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metilacetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, y además agua.

Los agentes de acuerdo con la invención además pueden comprender otros componentes, por ejemplo tensioactivos. Los tensioactivos útiles son los emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes que tienen propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estos tensioactivos. Ejemplos de los mismos son sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico, o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles) sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, lejías residuales de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es necesaria si uno de los principios activos y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación se efectúa en agua. La proporción de tensioactivos es entre 5 y 40 por ciento en peso del agente de acuerdo con la invención. Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarin, azoicos y de ftalocianina metálica, y oligonutrientes, tales como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Si fuese apropiado, además es posible que estén presentes otros componentes adicionales, por ejemplo, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, sustancias tixotrópicas, penetrantes, estabilizantes, secuestrantes, agentes de complejación. En general, los principios activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido habitualmente usado para fines de formulación. En general, las composiciones y formulaciones de acuerdo con la invención contienen entre 0,05 y 99 % en peso, 0,01 y 98 % en peso, preferentemente entre 0,1 y 95 % en peso, más preferentemente entre 0,5 y 90 % del principio activo, más preferentemente entre 10 y 70 por ciento en peso. Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden usar como tales, o, dependiendo de sus respectivas propiedades físicas y/o químicas, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, tales como aerosoles, suspensiones en cápsulas, concentrados de nebulización fría, concentrados de nebulización caliente, gránulos encapsulados, gránulos finos, concentrados fluidos para el tratamiento de la semilla, soluciones listas para usar, polvos para espolvoreo, concentrados emulsionables, emulsiones de aceite en agua, emulsiones de agua en aceite, macrogránulos, microgránulos, polvos dispersables en aceite, concentrados fluidos miscibles en aceite, líquidos miscibles en aceite, espumas, pastas, semillas recubiertas con plaguicidas, concentrados de suspensión, concentrados de suspoemulsión, concentrados solubles, suspensiones, polvos para pulverizar, polvos solubles, agentes de espolvoreo y gránulos, gránulos o comprimidos hidrosolubles, polvos solubles en agua para el tratamiento de la semilla, polvos humectables, productos naturales y sustancias sintéticas impregnados con el principio activo, y además microencapsulaciones en sustancias poliméricas y en materiales de revestimiento para semillas y además formulaciones de nebulización en frío o caliente ULV.

Las formulaciones mencionadas se pueden producir de una manera conocida per se, por ejemplo mezclando los principios activos con al menos un extensor, disolvente o diluyente, emulsionante, dispersante, y/o aglutinante o fijador habitual, agente humectante, repelente del agua, opcionalmente desecantes y estabilizadores UV y opcionalmente colorantes y pigmentos, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, agentes de adherencia secundarios, giberelinas y otros coadyuvantes de procesamiento.

Los agentes de acuerdo con la invención no solo incluyen las formulaciones ya listas para usar y que se pueden aplicar con el aparato adecuado sobre la planta o a la semilla, sino además los concentrados comerciales que deben ser diluidos con agua antes del uso. Los principios activos de acuerdo con la invención pueden estar presentes como están o en sus formulaciones (disponibles en el mercado) o además en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones como una mezcla con otros principios activos (conocidos), tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, herbicidas, fertilizantes, protectores y/o compuestos semioquímicos.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y las partes de las plantas con los principios activos o agentes se efectúa directamente o por la acción en sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo inmersión, pulverización, atomizado, irrigación, evaporación, espolvoreo, nebulización, voleo, espumado, pintura, unción, riego (empapamiento), irrigación por goteo y, en el caso del material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además mediante tratamiento en seco de la semilla, tratamiento húmedo de la semilla, tratamiento con suspensión, incrustación, revestimiento con uno o más recubridores, etc. Además es posible distribuir los principios activos mediante el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar la preparación del principio activo o el principio activo mismo en el suelo.

La invención además comprende un procedimiento para el tratamiento de la semilla. Además la invención se refiere a la semilla que ha sido tratada mediante uno de los procedimientos que se describen en el párrafo precedente. Las semillas de acuerdo con la invención se usan en procedimientos para la protección de la semilla de microorganismos no deseados. En estos se usa la semilla tratada con al menos un principio activo de acuerdo con la invención. Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención también son adecuados para el tratamiento de la semilla. Una gran parte del daño a las plantas de cultivo causada por los organismos dañinos se dispara por la infección de la semilla durante el almacenamiento o después del sembrado y además durante y después de la germinación de la planta. Esta fase es particularmente crítica dado que las raíces y los brotes de la planta en desarrollo son particularmente sensibles, y aún el menor daño puede dar como resultado la muerte de la planta. Por lo tanto hay un gran interés por proteger la semilla y la planta en germinación usando agentes apropiados.

El combate de hongos fitopatógenos mediante el tratamiento de la semilla de las plantas es conocido desde hace tiempo y es objeto de mejoras continuas. No obstante, el tratamiento de la semilla da lugar a una serie de problemas que no pueden ser siempre resueltos de manera satisfactoria. Por ejemplo, es deseable desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta en germinación que prescindan de, o al menos reduzcan significativamente, la aplicación adicional de agentes fitoprotectores con posterioridad a la siembra o después de la emergencia de las plantas. Además es deseable optimizar la cantidad de principio activo que se usa para proporcionar la máxima protección para la semilla y la planta en germinación del ataque de los hongos fitopatógenos, pero sin dañar la planta misma con el principio activo empleado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de la semilla deben tomar en consideración además las propiedades fungicidas intrínsecas de las plantas transgénicas a fin de obtener la protección óptima de la semilla y de la planta en germinación con un mínimo gasto de agentes fitoprotectores. Por lo tanto, la presente invención además se refiere a un procedimiento para la protección de la semilla y las plantas en germinación del ataque de los hongos fitopatógenos mediante el tratamiento de la semilla con un agente de acuerdo con la invención. De igual modo la invención se refiere al uso de los agentes de acuerdo con la invención para el tratamiento de la semilla para la protección de la semilla y la planta en germinación de los hongos fitopatógenos. La invención además se refiere a la semilla que ha sido tratada con un agente de acuerdo con la invención para la protección frente a hongos fitopatógenos.

El combate de los hongos fitopatógenos que dañan en pos-emergencia las plantas se lleva a cabo esencialmente tratando el suelo y las partes aéreas de las plantas con agentes fitoprotectores. Debido al interés respecto a una posible influencia del agente fitoprotector en el medio ambiente y la salud de los seres humanos y los animales, existen esfuerzos para reducir la cantidad de principios activos empleados.

Una de las ventajas de la presente invención es que las propiedades sistémicas particulares de los principios activos o los agentes de acuerdo con la invención significan que el tratamiento de la semilla con estos principios activos o agentes no solo protege la semilla misma, sino además las plantas resultantes después de la emergencia, de los hongos fitopatógenos. De esta manera, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después. De igual modo se considera ventajoso que los principios activos o los agentes de acuerdo con la invención se puedan usar especialmente también para las semillas transgénicas, en cuyo caso la planta que crece a partir de esta semilla es capaz de expresar una proteína que actúa contra las plagas. El tratamiento de esta semilla con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención, simplemente a través de la expresión de la proteína por ejemplo insecticida, puede dar por resultado que se combatan ciertas plagas. Sorprendentemente, en este caso se puede observar un efecto sinérgico adicional, que además aumenta la efectividad para la protección contra el ataque por parte de las plagas.

Los agentes de acuerdo con la invención son adecuados para proteger la semilla de cualquier cultivar de planta que se usa en la agricultura, en invernaderos, en bosques o en horticultura y viticultura. En particular, esta es la semilla de cereales (tal como trigo, cebada, centeno, triticale, sorgo/mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, habas, café, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, colza, amapola, oliva, coco, cacao, caña de azúcar, tabaco, hortalizas (tales como tomate, pepinos, cebollas y lechuga), césped y plantas ornamentales (véase además a continuación). El tratamiento de la semilla de cereales (tales como trigo, cebada, centeno, triticale y avena), maíz y arroz es de particular importancia. Como se describe además a continuación, el tratamiento de la semilla transgénica con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención es de particular importancia. Esto se refiere a la semilla de las plantas que contienen al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido o proteína con propiedades insecticidas. El gen heterólogo en la semilla transgénica se puede originar, por ejemplo, a partir de microorganismos de las especies *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. Este gen heterólogo se origina preferentemente a partir del *Bacillus* sp., en cuyo caso el producto génico es eficaz contra el barrenador de maíz

europeo (european corn borer) y/o el barrenador de maíz occidental. Más preferentemente el gen heterólogo se origina a partir del *Bacillus thuringiensis*.

5 En el contexto de la presente invención, el agente de acuerdo con la invención se aplica a la semilla solo o en una formulación adecuada. Preferentemente, la semilla se trata en un estado en el que es lo suficientemente estable, de modo que no se produce daño en el curso del tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Es habitual usar la semilla que se ha separado de la planta y se libera de las mazorcas, las cáscaras, los tallos, los revestimientos, los pelos o la pulpa de los frutos. Por ejemplo, es posible usar la semilla que ha sido cosechada, limpiada y secada hasta un contenido de humedad inferior al 15 % en peso. Como alternativa, además es posible usar la semilla que, después del secado, por ejemplo, ha sido tratada con agua y luego secada nuevamente.

10 En general, en el tratamiento de la semilla se debe asegurar que la cantidad de agente de acuerdo con la invención y/u otros aditivos aplicados a la semilla se seleccione de modo que la germinación de la semilla no se vea afectada y la planta que surge de la misma no se dañe. Esto se debería asegurar en particular en el caso de los principios activos que pueden tener efectos fitotóxicos en ciertas dosis de aplicación.

15 Los agentes de acuerdo con la invención se pueden aplicar directamente, es decir, sin que contengan otros componentes ni hayan sido diluidos. En general, es preferente aplicar los agentes a la semilla en la forma de una formulación adecuada. Las formulaciones adecuadas y los procedimientos para el tratamiento de la semilla son conocidos por el experto en la materia y se describen, por ejemplo, en los siguientes documentos: US 4.272.417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430, US 5.876.739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

20 Los principios activos que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden convertir en formulaciones habituales de protección de la semilla, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas u otras composiciones de revestimiento para la semilla, y además las formulaciones de ULV. Estas formulaciones se preparan de manera conocida mezclando los principios activos con los aditivos habituales, por ejemplo, los extensores y disolventes o diluyentes habituales, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y además agua.

25 Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de protección de las semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los colorantes que son habituales para estos fines. Es posible usar cualquier pigmento, que sea moderadamente soluble en agua, o colorantes, que sean solubles en agua. Los ejemplos incluyen los colorantes conocidos por los nombres Rhodamine B, C.I. Pigmento Rojo 112 y C.I. Disolvente Rojo 1.

30 Los agentes humectantes que pueden estar presentes en las formulaciones para la protección de semillas de acuerdo con la invención son todas las sustancias que promueven la humectación y que se usan de forma convencional para la formulación de los principios activos agroquímicos. Con preferencia se pueden usar alquilnaftalenosulfonatos, tales como diisopropil- o diisobutilnaftalenosulfonatos. Los dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar presentes en las formulaciones para el tratamiento de semillas que pueden usarse de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos que se usan de forma convencional para la formulación de los principios activos agroquímicos. Los dispersantes no iónicos o aniónicos o las mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos se pueden usar con preferencia. Los dispersantes no iónicos adecuados incluyen especialmente copolímeros de bloques de óxido de etileno-óxido de propileno, éteres de alquilfenol poliglicol y éteres de tristrilfenol poliglicol y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados son especialmente los lignosulfonatos, las sales de poli(ácido acrílico) y los condensados de arilsulfonato/formaldehído.

40 Los agentes antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones para la protección de semillas que pueden usarse de acuerdo con la invención son todas las sustancias supresoras de espuma que se usan de forma convencional para la formulación de los ingredientes activos agroquímicos. Los antiespumantes de silicona y el estearato de magnesio se pueden usar con preferencia.

45 Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones para la protección de semillas que pueden usarse de acuerdo con la invención son todas las sustancias adecuadas para este fin que se encuentran en los agentes agroquímicos. Los ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

50 Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones para la protección de semillas que pueden usarse de acuerdo con la invención son todas las sustancias útiles para este fin que se encuentran en los agentes agroquímicos. Los ejemplos preferentes incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice de alta dispersión.

55 Los adhesivos que pueden estar presentes en las formulaciones para la protección de semillas que pueden usarse de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes habituales que se pueden emplear en los productos para tratamiento de la semilla. Los ejemplos preferentes incluyen polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

Las formulaciones para la protección de semillas de acuerdo con la invención se pueden usar, o bien directamente o después de haber sido previamente diluidas con agua, para el tratamiento de un amplio intervalo de diferentes semillas, incluyendo la semilla de las plantas transgénicas. En este caso también pueden surgir efectos sinérgicos adicionales por la interacción con las sustancias que se forman por la expresión.

- 5 Para el tratamiento de la semilla con las formulaciones para la protección de la semilla que se puede usar de acuerdo con la invención, o las preparaciones producidas a partir de las mismas por la adición de agua, son útiles todas las unidades de mezclado que se usan habitualmente para la protección de la semilla. Específicamente, el procedimiento para la protección de la semilla consiste en colocar la semilla en una mezcladora, adicionar la cantidad deseada particular de la formulación de protección de la semilla, o bien como está o después de diluirla con
10 agua de antemano, y llevar a cabo el mezclado hasta que la formulación se distribuya de forma homogénea sobre la semilla. Si fuera apropiado, esto es seguido de una operación de secado.

Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención tienen potente actividad microbicida y se pueden usar para el control de microorganismos no deseados, tales como hongos y bacterias, en la fitoprotección y en la protección de materiales.

- 15 Se pueden usar fungicidas en la fitoprotección para el combate de Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes y Deuteromycetes.

Se pueden usar bactericidas en la fitoprotección para el combate de Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae y Streptomycetaceae.

- 20 Los agentes fungicidas de acuerdo con la invención se pueden usar para el combate curativo o protector de hongos fitopatógenos. Por lo tanto, la invención además se refiere también a los procedimientos curativos y protectores para controlar los hongos fitopatógenos mediante el uso de los principios activos o agentes de acuerdo con la invención, que se aplican a la semilla, la planta o las partes de la planta, al fruto o el suelo en el que se desarrollan las plantas.

- 25 Los agentes de acuerdo con la invención para el combate de hongos fitopatógenos en la fitoprotección comprenden una cantidad eficaz pero no fitotóxica de los principios activos de acuerdo con la invención. Una "cantidad eficaz pero no fitotóxica" significa una cantidad del agente de acuerdo con la invención que es suficiente para combatir la enfermedad fúngica de la planta de una manera satisfactoria o para erradicarla completamente, y que, al mismo tiempo, no causa ningún síntoma significativo de fitotoxicidad. En general, esta dosis de aplicación puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Depende de varios factores, por ejemplo del hongo que se vaya a combatir, la planta, las condiciones climáticas y los ingredientes de los agentes de acuerdo con la invención.

- 30 La buena tolerancia de la planta a los principios activos en las concentraciones requeridas para el combate de las enfermedades de la planta permite el tratamiento de las partes aéreas de las plantas, de las reservas de propagación y las semillas, y del suelo.

- 35 De acuerdo con la invención se pueden tratar todas las plantas y partes de plantas. Por plantas se entiende todas las plantas y las poblaciones de plantas, tales como las plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (que incluyen las plantas de cultivo que se producen en forma natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se obtienen mediante procedimientos de reproducción selectiva y optimización convencionales o mediante procedimientos de ingeniería biotecnológica y genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas y los cultivares que pueden ser protegidos y no protegidos por los derechos de los reproductores de plantas. Por partes de planta debe entenderse todas las partes y los órganos de plantas por encima y por debajo del suelo, tales como el retoño, la hoja, la flor y la raíz, ejemplos de los cuales incluyen las
40 hojas, acículas, los tallos, las ramas, flores, los cuerpos fructíferos, los frutos, las semillas y las raíces, los tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas además incluyen el material cosechado y el material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

- 45 Los principios activos de acuerdo con la invención, dada la buena compatibilidad de la planta, la toxicidad homeotérmica favorable y la buena compatibilidad ambiental, son adecuados para la protección de plantas y órganos de plantas, para incrementar los rendimientos de la cosecha, para mejorar la calidad del cultivo cosechado. Preferentemente se pueden usar en forma de agentes fitoprotectores. Son eficaces contra las especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas etapas del desarrollo.

- 50 Las plantas que pueden ser tratadas de acuerdo con la invención incluyen las siguientes plantas de cultivo principales: maíz, soja, algodón, semillas oleaginosas Brassica, tales como Brassica napus (por ejemplo canola), Brassica rapa, B. juncea (por ejemplo mostaza (de campo)) y Brassica carinata, arroz, trigo, remolacha, caña de azúcar, avena, cebada, centeno, mijo, sorgo, triticale, lino, uvas y varios frutos y hortalizas de varios taxones botánicos, por ejemplo Rosaceae sp. (por ejemplo frutas de pepita tales como manzanas y peras, pero además frutas de hueso tales como albaricoques, cerezas, almendras y duraznos, y frutos rojos tales como fresas),
55 Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (por ejemplo árboles de plátano y plantaciones), Rubiaceae sp. (por ejemplo café), Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (por ejemplo, limones, naranjas y pomelos); Solanaceae sp. (por ejemplo tomates, patatas, pimientos, berenjenas), Liliaceae sp., Compositae sp., (por ejemplo lechuga,

5 alcachofas y endibias incluyendo endibias de raíz, endivias o endibia común), Umbelliferae sp. (por ejemplo zanahorias, perejil, apio y apio-nabo), Cucurbitaceae sp. (por ejemplo pepinos - incluyendo pepinillos, zapallos, sandías, calabazas y melones), Alliaceae sp. (por ejemplo puerros y cebollas), Cruciferae sp. (por ejemplo repollo blanco, repollo colorado, brócoli, coliflor, repollitos de Bruselas, pak choi, kohlrabi, rábanos, rábanos picantes, berros y repollos chinos), Leguminosae sp. (por ejemplo cacahuets, guisantes, lentejas y habas - por ejemplo, habas comunes y habas anchas), Chenopodiaceae sp. (por ejemplo acelga, remolacha forrajera, espinaca, remolacha), Malvaceae (por ejemplo oca), Asparagaceae (por ejemplo espárragos); plantas útiles y plantas ornamentales en el jardín y bosques; y en cada caso especies genéticamente modificadas de estas plantas.

10 Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferente, se tratan las especies de plantas salvajes y los cultivares de plantas, o los que se obtienen mediante reproducción biológica convencional, tal como la fusión por cruce o de protoplastos, y además sus partes. En una forma de realización preferente más, se tratan las plantas transgénicas y los cultivares de plantas que se obtienen por ingeniería genética, si fuese apropiado en combinación con los procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente), y sus partes. El término "partes" o "partes de las plantas" o "partes de una planta" ha sido explicado anteriormente. Más preferentemente, las plantas de los cultivares de plantas que están cada una disponible en el mercado o en uso se tratan de acuerdo con la invención. Por cultivares de plantas debe entenderse las plantas con nuevas propiedades ("rasgos") y que han sido obtenidas mediante reproducción convencional, por mutagénesis o mediante las técnicas de ADN recombinante. Pueden ser cultivares, variedades, biotipos o genotipos.

20 El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención se puede usar para el tratamiento de organismos genéticamente modificados (OMG), por ejemplo, plantas o semillas. Las plantas genéticamente modificadas (o plantas transgénicas) son plantas en las cuales un gen heterólogo ha sido integrado en forma estable dentro del genoma. La expresión "gen heterólogo" significa esencialmente un gen que es proporcionado o ensamblado fuera de la planta y cuando se introduce en el genoma nuclear, el genoma cloroplástico o el genoma mitocondrial da a la planta transformada nuevas o mejoradas propiedades agronómicas y otras propiedades al expresar una proteína o polipéptido de interés o por regulación por disminución o silenciamiento de otro gen u otros genes que están presentes en la planta (usando por ejemplo, tecnología de antisentido, tecnología de cosupresión o tecnología de ARNi [interferencia de ARN]). Un gen heterólogo que está presente en el genoma además se denomina transgén. Un transgén que se define por su ubicación particular en el genoma de la planta se denomina un acontecimiento de transformación o transgénico.

25 Dependiendo de las especies de la planta o los cultivares de plantas, sus condiciones de ubicación y crecimiento (suelos, clima, período de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede dar como resultado efectos superaditivos ("sinérgicos"). Por ejemplo son posibles los siguientes efectos que exceden los efectos que realmente se esperan: dosis de aplicación reducidos y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un aumento en la eficacia de los principios activos y las composiciones que se pueden usar de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de la planta, tolerancia aumentada a temperaturas elevadas o bajas, tolerancia aumentada a la sequía o al agua o al contenido salobre del suelo, rendimiento aumentado de la floración, cosechas más fáciles, maduración acelerada, rendimientos más altos de la cosecha, frutos más grandes, altura más alta de la planta, color de la hoja más verde, floración más temprana, calidad superior y/o un valor nutricional más alto de los productos cosechados, concentración de azúcar más alta dentro de los frutos, mejor estabilidad al almacenamiento y/o al procesamiento de los productos cosechados..

35 A ciertas dosis de aplicación, las combinaciones del principio activo de acuerdo con la invención también pueden tener un efecto fortificante en las plantas. Por consiguiente, estos además son adecuados para movilizar el sistema de defensa de las plantas contra los ataques de hongos fitopatógenos y/o microorganismos no deseados. Si fuera apropiado, esta puede ser una de las razones de la actividad mejorada de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo contra los hongos. Por sustancias de fortalecimiento de la planta (que inducen resistencia) se debe entender que, en el presente contexto, significan además aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas de tal manera que, cuando se inoculan de forma subsiguiente con hongos fitopatógenos no deseados, las plantas tratadas despliegan un grado sustancial de resistencia a estos hongos fitopatógenos no deseados. Por lo tanto, las sustancias de acuerdo con la invención se pueden usar para la protección de plantas del ataque de los patógenos mencionados dentro de un cierto período después del tratamiento. El período dentro del cual se obtiene la protección se extiende en general desde 1 a 10 días, preferentemente 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los principios activos. Las plantas y los cultivares de plantas que se tratan preferentemente de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que tienen material genético que imparte rasgos útiles, particularmente ventajosos a estas plantas (independientemente de si se obtienen por medios de reproducción y/o biotecnológicos).

Las plantas y los cultivares de plantas que se tratan de igual modo preferentemente de acuerdo con la invención son resistentes a uno o más factores de estrés biótico, es decir estas plantas tiene una mejor defensa contra las plagas animales o microbianas, tales como nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

60 Ejemplos de plantas resistentes a nematodos se describen, por ejemplo, en las siguientes solicitudes de patente de los EE. UU.: 11/765.491, 11/765.494, 10/926.819, 10/782.020, 12/032.479, 10/783.417, 10/782.096, 11/657.964,

12/192.904, 11/396.808, 12/166.253, 12/166.239, 12/166.124, 12/166.209, 11/762.886, 12/364.335, 11/763.947, 12/252.453, 12/209.354, 12/491.396 y 12/497.221.

5 Plantas y cultivares de plantas que se pueden tratar también de acuerdo con la invención son aquellas plantas que son resistentes a uno o más factores de estrés abiótico. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a las temperaturas frías, exposición al calor, estrés osmótico, saturación hídrica, salinidad del suelo incrementada, exposición a minerales aumentada, exposición al ozono, exposición a la luz fuerte, disponibilidad limitada de nutrientes de nitrógeno, disponibilidad limitada de nutrientes fosforosos o evitación de sombra.

10 Plantas y cultivares de plantas que se pueden tratar además de acuerdo con la invención son aquellas plantas que se caracterizan por las características de rendimiento mejorado. El rendimiento potenciado en estas plantas puede ser el resultado de, por ejemplo, la fisiología mejorada de la planta, el crecimiento y desarrollo, tales como la eficiencia del uso del agua, la eficiencia de retención del agua, el uso mejorado del nitrógeno, la asimilación del carbono mejorado, la fotosíntesis mejorada, la eficiencia mejorada de la germinación y la maduración acelerada. El rendimiento además se puede ver afectado por la arquitectura mejorada de la planta (en condiciones de estrés y no estrés), que incluye la floración temprana, el control de la floración para la producción de la semilla híbrida, el vigor de la plántula, el tamaño de la planta, el número y la distancia entre nudos, el crecimiento de la raíz, el tamaño de la semilla, el tamaño del fruto, el tamaño del capullo, el número de capullos o mazorcas, el número de semillas por capullo o mazorca, la masa de la semilla, el relleno de la semilla mejorado, la dispersión de la semilla reducida, la dehiscencia del capullo reducida y la resistencia al encamado. Otros rasgos de rendimiento incluyen la composición de la semilla, tal como el contenido de carbohidratos, el contenido de proteínas, el contenido de aceite y la composición de aceite, el valor nutricional, la reducción de los compuestos antinutricionales, el procesamiento mejorado y la mejor estabilidad al almacenamiento.

25 Plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas híbridas que ya expresan la característica de heterosis o efecto híbrido que da por resultado un rendimiento en general más alto, vigor, mejor salud y resistencia hacia los factores de estrés biótico y abiótico. Normalmente estas plantas se producen cruzando una línea parental macho-estéril endogámica (el compañero de cruzamiento parental hembra) con otra línea parental macho-fértil endogámica (el compañero de cruzamiento parental macho). Las semillas híbridas normalmente se cosechan a partir de las plantas macho estériles y se venden a los cultivadores. Algunas veces las plantas estériles macho (por ejemplo, en el maíz) se producen por despendonación, (es decir, la retirada mecánica de los órganos reproductivos machos o flores machos) pero, más normalmente, la esterilidad macho es el resultado de los determinantes genéticos en el genoma de la planta. En ese caso, y especialmente cuando la semilla es el producto deseado que debe ser cosechado a partir de las plantas híbridas, es normalmente beneficioso para garantizar que la fertilidad macho en las plantas híbridas, que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad macho, esté totalmente restaurada. Esto puede obtenerse garantizando que las líneas parentales macho tengan genes restauradores de la fertilidad apropiados que sean capaces de restaurar la fertilidad macho en plantas híbridas que contengan los determinantes genéticos responsables de la esterilidad macho. Los determinantes genéticos para la esterilidad macho se pueden localizar en el citoplasma. Los ejemplos de esterilidad macho citoplasmática (CMS) fueron por ejemplo descritos en las especies Brassica. Sin embargo, los determinantes genéticos para la esterilidad del maíz además se pueden localizar en el genoma nuclear. Las plantas estériles macho además se pueden obtener mediante los procedimientos de biotecnología de plantas tal como la ingeniería genética. Un medio particularmente útil para obtener las plantas estériles macho se describe en el documento WO 89/10396 en el que, por ejemplo, una ribonucleasa tal como la barnasa se expresa selectivamente en las células de tapetum en los estambres. A continuación la fertilidad se puede restaurar por la expresión en las células de tapetum de un inhibidor de ribonucleasa tal como barstar.

45 Plantas o cultivares de plantas (que se obtienen mediante procedimientos de biotecnología tal como la ingeniería genética) que se pueden tratar de acuerdo con la invención son las plantas tolerantes a herbicidas, es decir las plantas que se hacen tolerantes a uno o más herbicidas dados. Estas plantas se pueden obtener o bien por transformación genética, o por la selección de plantas que contienen una mutación que imparte esta tolerancia al herbicida. Las plantas tolerantes a herbicidas son por ejemplo las plantas que toleran el glifosato, es decir plantas que se hacen tolerantes al glifosato herbicida o sus sales. Las plantas se pueden hacer tolerantes al glifosato a través de varios procedimientos. Por ejemplo, las plantas tolerantes al glifosato se pueden obtener transformando la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS). Los ejemplos de los genes de esta EPSPS son el gen AroA (CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium* (Comai y col., 1983, Science 221, 370-371), el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium* sp. (Barry y col., 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145), los genes que codifican una EPSPS de *petunia* (Shah y col., 1986, Science 233, 478-481), una EPSPS de *tomate* (Gasser y col., 1988, J. Biol. [Chem. 263, 4280-4289] o una EPSPS de *Eleusina* (documento WO 01/66704). Además puede ser una EPSPS mutada. Las plantas tolerantes al glifosato además se pueden obtener expresando un gen que codifica una enzima glifosato oxidorreductasa. Las plantas tolerantes al glifosato además se pueden obtener expresando un gen que codifica una enzima glifosato acetiltransferasa. Las plantas tolerantes al glifosato además se pueden obtener seleccionando las plantas que contienen mutaciones que se producen en forma natural de los genes antes mencionados. Se han descrito plantas que expresan los genes de la EPSPS que imparten tolerancia al glifosato. Se han descrito plantas que expresan otros genes que imparten tolerancia al glifosato, por ejemplo genes de decarboxilasa. Otras plantas resistentes a herbicidas son por ejemplo las plantas que se hacen

tolerantes a los herbicidas inhibiendo la enzima glutamina sintasa, tales como bialafos, a o glufosinato. Estas plantas se pueden obtener mediante la expresión de una enzima que elimina la toxicidad del herbicida o una enzima mutante glutamina sintasa que es resistente a la inhibición. Una enzima que elimina la toxicidad eficiente de este tipo es, por ejemplo, una enzima que codifica una fosfinotricina acetiltransferasa (tal como la proteína bar o pat de especies de *Streptomyces*). Se han descrito plantas que expresan una fosfinotricina acetiltransferasa exógena.

Otras plantas tolerantes a los herbicidas además son plantas que se han hecho tolerantes a los herbicidas que inhiben la enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la cual para-hidroxifenilpiruvato (HPP) se convierte a homogentisato. Las plantas tolerantes a los inhibidores de HPPD se pueden transformar con un gen que codifica una enzima HPPD resistente que se produce de forma natural, o un gen que codifica una enzima HPPD mutada o quimérica como se describe en los documentos WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 o US 6.768.044. La tolerancia a los inhibidores HPPD además se puede obtener mediante la transformación de las plantas con genes que codifican ciertas enzimas que permiten la formación del homogentisato a pesar de la inhibición de la enzima HPPD natural por parte del inhibidor de HPPD. Estas plantas se describen en los documentos WO 99/34008 y WO 02/36787. La tolerancia de las plantas a los inhibidores de la HPPD además se puede mejorar mediante la transformación de las plantas con un gen que codifica una enzima preferato deshidrogenasa además de un gen que codifica una enzima tolerante a la HPPD, como se describe en el documento WO 2004/024928. Además, las plantas se pueden hacer más tolerantes a los inhibidores de la HPPD insertando en el genoma de las mismas un gen que codifica una enzima que metaboliza o degrada los inhibidores de la HPPD, por ejemplo las enzimas CYP450 (véase los documentos WO 2007/103567 y WO 2008/150473). Son otras plantas resistentes a los herbicidas plantas que se hacen tolerantes a los inhibidores de acetolactato sintasa (ALS). Los inhibidores de la ALS conocidos incluyen, por ejemplo, los herbicidas de sulfonilurea, imidazolinona, triazolpirimidinas, pirimidinioxi(tio)benzoatos y/o sulfonilaminocarbonilimidazolinona. Se sabe que diferentes mutaciones en la enzima ALS (también conocida como acetohidroxiácido sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas y grupos de herbicidas, como se describe, por ejemplo, en Tranel & Wright (Weed Science 2002, 50, 700-712). Se ha descrito la producción de plantas tolerantes a la sulfonilurea y plantas tolerantes a la imidazolinona. Además se han descrito más plantas tolerantes a la imidazolinona y sulfonilurea.

Otras plantas tolerantes a la imidazolinona y/o sulfonilurea se pueden obtener por mutagénesis inducida, por la selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o reproducción por mutación (cf., ejemplo para las habas de soja con el documento US 5.084.082, para el arroz en el documento WO 97/41218, para la remolacha en el documento US 5.773.702 y en el documento WO 99/5.198.599, para la lechuga en el documento US 5.198.599 o para el girasol en el documento WO 01/065922).

Las plantas o cultivares de plantas (que se obtienen mediante procedimientos de biotecnología tal como la ingeniería genética) que se pueden tratar también de acuerdo con la invención son las plantas transgénicas resistentes a los insectos, es decir las plantas que se hacen resistentes al ataque de ciertos insectos específicos. Estas plantas se pueden obtener o bien por transformación genética, o por la selección de plantas que contienen una mutación que imparte esta resistencia a los insectos.

La expresión "planta transgénica resistente a los insectos", tal como se usa en el presente contexto, incluye cualquier planta que contiene al menos un transgén que comprende una secuencia codificante que codifica:

- 1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una porción insecticida de la misma, tales como las proteínas cristalinas insecticidas compiladas en Crickmore y col. (Microbiology y Molecular Biology Reviews 1998, 62, 807-813), actualizado por Crickmore y col. (2005) en la nomenclatura de la toxina *Bacillus thuringiensis*, en línea en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, o porciones insecticidas de la misma, por ejemplo, proteínas de las clases de la proteína Cry Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1B, Cry1C, Cry1D, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa o Cry3Bb o porciones insecticidas de las mismas (por ejemplo documentos EP-A 1999141 y WO 2007/107302), o aquellas proteínas codificadas por los genes sintéticos como se describe por ejemplo, en la solicitud de patente de los EE.UU. 12/249.016; o
- 2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una porción de la misma que es insecticida en presencia de una segunda proteína cristalina diferente de *Bacillus thuringiensis* o una porción de la misma, tal como la toxina binaria compuesta de las proteínas cristalinas Cry34 y Cry35 (Nat. Biotechnol. 2001, 19, 668-72; Applied Environm. Microbiol. 2006, 71, 1765-1774) o la toxina binaria compuesta de las proteínas Cry1A o Cry1F y las proteínas Cry2Aa o Cry2Ab o Cry2Ae (solicitud de patente de los EE.UU. 12/214.022 y documento EP08010791.5); o
- 3) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de dos diferentes proteínas cristalinas insecticidas de *Bacillus thuringiensis*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo, la proteína Cry1A.105 que se produce por el acontecimiento del maíz MON89034 (documento WO 2007/027777); o
- 4) una proteína de cualquiera de los puntos 1) a 3) anteriores en la que, algunos, en particular 1 a 10, aminoácidos han sido sustituidos por otros aminoácidos para obtener una actividad insecticida superior para una especie de insecto específica, y/o expandir el intervalo de especies de insectos específicas afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación, tal como la proteína Cry3BB1 en los acontecimientos del maíz MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en el acontecimiento del

maíz MIR604; o

5) una proteína insecticida secretada por el *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una porción insecticida de la misma, tales como las proteínas tóxicas para insectos de efecto vegetativo (vegetative insecticidal proteins, VIP) mencionadas en http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

6) una proteína secretada por el *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una segunda proteína secretada por el *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como la toxina binaria producida de las proteínas VIP1A y VIP2A (documento WO 94/21795); o

7) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas secretadas por *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior; o

8) una proteína de cualquiera de los puntos 5) a 7) anteriores en la que, algunos, en particular 1 a 10, aminoácidos han sido sustituidos por otros aminoácidos para obtener una actividad insecticida superior para una especie de insecto específica, y/o expandir el intervalo de especies de insectos específicas afectadas, y/o debido a los cambios inducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación, (mientras aún codifica una proteína insecticida), tal como la proteína VIP3Aa en el acontecimiento de algodón COT102; o

9) una proteína secretada por *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis*, tal como la toxina binaria compuesta de VIP3 y Cry1A o Cry1F (solicitudes de patente de los EE.UU. 61/126083 y 61/195019), o la toxina binaria compuesta de la proteína VIP3 y las proteínas Cry2Aa o Cry2Ab o Cry2Ae (solicitud de patente de los EE.UU. 12/214,022 y EP 08010791.5); o

10) una proteína de acuerdo con el punto 9) anterior en la que algunos, en particular 1 a 10, aminoácidos han sido sustituidos por otros aminoácidos para obtener una actividad insecticida superior para una especie de insecto específica, y/o expandir el intervalo de especies de insectos específicas afectadas, y/o debido a los cambios inducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación, (mientras aún codifica una proteína insecticida). Por supuesto, las plantas transgénicas resistentes a los insectos, como se usa en el presente contexto, además incluyen cualquier planta que comprenda una combinación de genes que codifican las proteínas de cualquiera de las clases anteriores 1 a 10. En una realización, una planta resistente a los insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de cualquiera de las clases anteriores 1 a 10, para expandir el espectro de las especies de insectos específicos afectados o para retardar el desarrollo de resistencia a los insectos en las plantas usando diferentes proteínas insecticidas para la misma especie de insecto específica, pero con un modo diferente de acción, tal como la unión a diferentes sitios de unión al receptor en el insecto.

En el presente contexto, una "planta transgénica resistente a insectos" además incluye cualquier planta que contiene al menos un transgén que comprende una secuencia para la producción de ARN bicatenario, que, después del consumo de alimento por parte de una plaga de insecto, evita el desarrollo de esta plaga.

Plantas o cultivares de plantas (que se obtienen mediante los procedimientos de biotecnología de la planta tal como la ingeniería genética) que además se pueden tratar de acuerdo con la invención, son los tolerantes a factores de estrés abiótico. Estas plantas se pueden obtener o bien por transformación genética, o por la selección de plantas que contienen una mutación que imparte esta resistencia al estrés. Las plantas tolerantes al estrés particularmente útiles incluyen las siguientes:

a. plantas que contienen un transgén capaz de reducir la expresión y/o la actividad del gen de la poli(ADP-ribosa) polimerasa (PARP) en las células vegetales o las plantas.

b. plantas que contienen un transgén que mejora la tolerancia al estrés capaz de reducir la expresión y/o la actividad de los genes que codifican PARG de las plantas o las células vegetales;

c. plantas que contienen un transgén que mejora la tolerancia al estrés que codifica una enzima funcional de la planta de la ruta de la biosíntesis natural del dinucleótido de la nicotinamida adenina que incluye la nicotinamidasa, nicotinato fosforribosiltransferasa, ácido nicotínico mononucleótido adenil transferasa, nicotinamida adenina dinucleótido sintasa o nicotina amida fosforribosiltransferasa.

Plantas o cultivares de plantas (que se obtienen mediante procedimientos de biotecnología tal como la ingeniería genética) que además se pueden tratar de acuerdo con la invención muestran una cantidad, calidad y/o estabilidad al almacenamiento del producto cosechado alterada y/o las propiedades de los principios específicos del producto cosechado alteradas tales como por ejemplo:

1) plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado que está alterado con respecto a sus características químofísicas, en particular el contenido de amilosa o la relación de amilosa/amilopectina, el grado de ramificación, la longitud de cadena promedio, la distribución de las cadenas laterales, el comportamiento de la viscosidad, la resistencia a la gelificación, el tamaño del grano del almidón y/o la morfología del grano de almidón en comparación al almidón sintetizado en las plantas o células vegetales de tipo natural, de modo que este almidón modificado se adecua mejor para ciertas aplicaciones.

2) plantas transgénicas que sintetizan polímeros de carbohidrato no almidón o que sintetizan polímeros de carbohidrato no almidón con propiedades alteradas en comparación con las plantas de tipo natural sin modificación genética. Son ejemplos plantas que producen polifruktosa, especialmente del tipo inulina y levano, plantas que producen alfa-1,4-glucanos, plantas que producen alfa-1,4-glucanos alfa-1,6-ramificados, y plantas

que producen alternano.

3) plantas transgénicas que producen hialuronano.

4) plantas transgénicas o plantas híbridas, tales como cebollas con propiedades particulares, tales como "elevado contenido de sólidos solubles" (high soluble solids content), "baja acritud" (low pungency, LP) y/o "largo almacenamiento" (long storage, LS).

5 Plantas o cultivares de plantas (que se obtuvieron mediante procedimientos de biotecnología vegetal tal como la ingeniería genética) que además se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas, tales como plantas de algodón, con características alteradas de la fibra. Estas plantas se pueden obtener por transformación genética, o por la selección de plantas que contienen una mutación que imparte estas características alteradas de la fibra e incluyen:

- 10 a) plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los genes de la celulosa sintasa;
 b) plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los ácidos nucleicos homólogos a rsw2 o rsw3, tales como plantas de algodón con una expresión aumentada de sacarosa fosfato sintasa;
 c) plantas, tales como plantas de algodón, con la expresión aumentada de la sacarosa sintasa,
 15 d) plantas, tales como plantas de algodón, en las que la sincronización de las compuertas de plasmodesmos en la base de la célula de la fibra se altera, por ejemplo, por regulación por disminución de la β -1,3-glucanasa de fibra selectiva;
 e) plantas, tales como plantas de algodón, que tienen fibras con reactividad alterada, por ejemplo, a través de la expresión del gen de N-acetilglucosamina transferasa que incluye los genes nodC y quitina sintasa.

20 Plantas o cultivares de plantas (que se obtuvieron mediante procedimientos de biotecnología vegetal tal como la ingeniería genética) que además se pueden tratar de acuerdo con la invención, son plantas de colza o plantas de Brassica relacionadas con características alteradas de la composición de aceite. Estas plantas se pueden obtener por transformación genética, o por la selección de plantas que contienen una mutación que imparte estas características alteradas del aceite e incluyen:

- 25 a) plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un alto contenido de ácido oleico;
 b) plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite con un bajo contenido de ácido linoléico;
 c) plantas, tales como las plantas de colza, que producen aceite con un bajo contenido de ácidos grasos saturados.

30 Plantas o cultivares de plantas (que se pueden obtener mediante procedimientos de biotecnología vegetal tal como la ingeniería genética) que además se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas, tales como las patatas que son resistentes a los virus, por ejemplo, contra el virus Y de la patata (acontecimientos SY230 y SY233 de Tecnoplant, Argentina), o que son resistentes a enfermedades, tales como el tizón tardío de la patata (potato late blight) (por ejemplo el gen RB), o que exhiben una reducción en el endulzamiento inducido por el frío (que portan los genes Nt-Inhh, IIR-INV) o que exhiben un fenotipo enano (Gen A-20 oxidasa).

35 Plantas o cultivares de plantas (que se obtuvieron mediante procedimientos de biotecnología vegetal tal como la ingeniería genética) que además se pueden tratar de acuerdo con la invención, son plantas de colza o plantas de Brassica relacionadas con características alteradas de destrucción de la semilla. Estas plantas se pueden obtener por transformación genética, o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte estas características alteradas, e incluyen plantas tales como la colza con caída de semilla retardada o reducida.

40 Plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que contienen acontecimientos de transformación o combinaciones de los acontecimientos de transformación, que son objeto de peticiones otorgadas o pendientes para el estado no regulado, en los Estados Unidos de América, al Servicio de Inspección, Salud Animal y Vegetal (APHIS) del Departamento de Agricultura de los Estados Unidos (USDA). La información relacionada está disponible en cualquier momento de APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, EEUU), por ejemplo mediante el sitio web http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html. A la fecha de presentación de
 45 esta solicitud, las peticiones con la siguiente información fueron otorgadas o estaban pendientes en el APHIS:

- Petición: Número de identificación de la petición. La descripción técnica de los acontecimientos de transformación se puede hallar en los documentos de petición específicos del APHIS, por ejemplo en el sitio web mediante el número de petición.
- Extensión de una petición: Referencia a una petición anterior para la que se está solicitando una extensión de alcance o término.
- 50 – Institución: Nombre de la persona que entrega la petición.
- Artículo regulado: La especie de planta en cuestión.
- Fenotipo transgénico: El rasgo (trait) conferido a la planta por el acontecimiento de transformación.
- Evento o línea de transformación: El nombre del acontecimiento o los acontecimientos (algunas veces también denominado línea o líneas) para los que se solicita el estado no regulado.
- 55 – Documentos del APHIS: Varios documentos que han sido publicados por APHIS con respecto a la petición o se pueden obtener del APHIS a solicitud. Las plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que comprenden uno o más genes que codifican una o más toxinas, y son las plantas transgénicas las que se comercializan bajo los siguientes nombres comerciales: YIELD GARD® (por ejemplo

maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), BiteGard® (por ejemplo maíz), BT-Xtra® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotr® (algodón), Nucotr 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas tolerantes al herbicida que deberían mencionarse son cultivares de maíz, cultivares de algodón y cultivares de soja que están disponibles bajo los siguientes nombres comerciales: Roundup Ready® (tolerancia al glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinona) y SCS® (tolerancia a sulfonilurea, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicida (plantas producidas de una manera convencional para su tolerancia a herbicida) que se pueden mencionar incluyen los cultivares que se comercializan bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz común).

Plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que contienen acontecimientos de transformación, o una combinación de los acontecimientos de transformación y que se mencionan por ejemplo en las bases de datos de varias agencias reguladoras nacionales o regionales (véase por ejemplo http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y http://ceramgmc.org/index.php?evidcode=&hstlDXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&colDCode=&action=gm_crop_database&mode=Submit).

Los principios activos o los agentes de acuerdo con la invención también se pueden usar aparte de en la protección de materiales, para la protección de materiales industriales contra el ataque y la destrucción por microorganismos no deseados, por ejemplo hongos e insectos.

Además, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar como composiciones antiincrustantes, solos o en combinaciones con otros principios activos.

Se entiende que los materiales técnicos en el presente contexto significan materiales inanimados que han sido preparados para su uso en la industria. Por ejemplo, los materiales técnicos que deben protegerse por principios activos de la invención de la alteración o destrucción microbiana pueden ser adhesivos, aprestos, papel, cartulina y cartón, textiles, alfombras, cuero, madera, pinturas y artículos plásticos, lubricantes de refrigeración y otros materiales que se pueden infectar o destruir por microorganismos. El intervalo de materiales a ser protegido además incluye partes de edificios y plantas de producción, por ejemplo circuitos de agua de refrigeración, sistemas de enfriamiento y calefacción, y unidades de acondicionamiento de aire, que pueden ser afectados por la proliferación de microorganismos. Los materiales técnicos dentro del alcance de la presente invención incluyen preferentemente adhesivos, aprestos, papeles y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes de refrigeración y fluidos para la transferencia de calor, más preferentemente madera. Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención pueden prevenir efectos adversos, tales como podredumbre, descomposición, decoloración o formación de moho. Además, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar para la protección de objetos que se ponen en contacto con el agua marina o el agua salobre, especialmente, cascos, cribas, redes, construcciones, anclajes y sistemas de señalización, de la incrustación.

El procedimiento de acuerdo con la invención para combatir hongos no deseados también se puede emplear para proteger los denominados productos de almacenamiento. Se entiende por productos de almacenamiento a este respecto las sustancias naturales de origen vegetal o animal o productos procesados de los mismos que son de origen natural, y para los cuales se desea la protección a largo plazo. Los productos de almacenamiento de origen vegetal, por ejemplo plantas o partes de plantas, tales como tallos, hojas, tubérculos, semillas, frutos, granos, se pueden proteger recién cosechados o después del procesamiento por (pre)secado, humectación, trituración, molienda, prensado o tostado. Los productos de almacenamiento también incluyen madera, ya sea sin procesar, tal como madera para la construcción, mástiles y barreras de electricidad, o en la forma de productos terminados, tales como muebles. Los productos de almacenamiento de origen animal son, por ejemplo, pelajes, cueros, pieles y pelos. Los principios activos de acuerdo con la invención pueden prevenir efectos adversos, tales como podredumbre, descomposición, decoloración o formación de moho.

Ejemplos no limitantes de patógenos de enfermedades fúngicas que se pueden tratar de acuerdo con la invención incluyen: enfermedades causadas por patógenos del oidio sobre trigo, por ejemplo la especie *Blumeria*, por ejemplo, *Blumeria graminis*; la especie *Podosphaera*, por ejemplo *Podosphaera leucotricha*; la especie *Sphaerotheca*, por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*; la especie *Uncinula*, por ejemplo *Uncinula necator*; enfermedades causadas por patógenos de la enfermedad de la roya, por ejemplo la especie *Gymnosporangium*, por ejemplo *Gymnosporangium sabiniae*; la especie *Hemileia*, por ejemplo *Hemileia vastatrix*; la especie *Phakopsora*, por ejemplo *Phakopsora pachyrhizi* y *Phakopsora meibomia*; la especie *Puccinia*, por ejemplo *Puccinia recondita* o *Puccinia triticina*; la especie *Uromyces*, por ejemplo *Uromyces appendiculatus*; enfermedades causadas por patógenos del grupo de los Oomycetes, por ejemplo la especie *Bremia*, por ejemplo *Bremia lactucae*; la especie *Peronospora*, por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*; la especie *Phytophthora*, por ejemplo *Phytophthora infestans*; la especie *Plasmopara*, por ejemplo *Plasmopara viticola*; la especie *Pseudoperonospora*, por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*; la especie *Pythium*, por ejemplo *Pythium ultimum*; enfermedades de la mancha de la hoja y enfermedades del marchitamiento de la hoja causadas por ejemplo, por la especie *Alternaria*, por ejemplo *Alternaria solani*; la especie *Cercospora*, por ejemplo *Cercospora beticola*; la especie *Cladosporium*, por ejemplo *Cladosporium cucumerinum*; la especie *Cochliobolus*, por ejemplo *Cochliobolus sativus* (forma conidia: *Drechslera*, sin: *Helminthosporium*); la especie *Colletotrichum*, por ejemplo *Colletotrichum lindemuthianum*; la especie *Cyloconium*, por ejemplo *Cyloconium oleaginum*; la especie *Diaporthe*, por ejemplo *Diaporthe citri*; la especie *Elsinoe*, por ejemplo *Elsinoe fawcettii*; la especie *Gloeosporium*, por ejemplo *Gloeosporium laeticolor*; la especie *Glomerella*, por ejemplo *Glomerella cingulata*; la especie *Guignardia*, por ejemplo

Guignardia bidwelli; la especie Leptosphaeria, por ejemplo Leptosphaeria maculans; la especie Magnaporthe, por ejemplo Magnaporthe grisea; la especie Microdochium, por ejemplo Microdochium nivale; la especie Mycosphaerella, por ejemplo Mycosphaerella graminicola y M. fijiensis; la especie Phaeosphaeria, por ejemplo Phaeosphaeria nodorum; la especie Pyrenophora, por ejemplo Pyrenophora teres; la especie Ramularia, por ejemplo Ramularia collo-cygni; la especie Rhynchosporium, por ejemplo Rhynchosporium secalis; la especie Septoria, por ejemplo Septoria apii; la especie Typhula, por ejemplo Typhula incarnata; la especie Venturia, por ejemplo Venturia inaequalis; enfermedades sobre raíces y tallo causadas, por ejemplo, por la especie Corticium, por ejemplo Corticium graminearum; la especie Fusarium, por ejemplo Fusarium oxysporum; la especie Gaeumannomyces, por ejemplo Gaeumannomyces graminis; la especie Rhizoctonia, por ejemplo Rhizoctonia solani; la especie Tapesia, por ejemplo Tapesia acuformis; la especie Thielaviopsis, por ejemplo Thielaviopsis basicola; enfermedades de la mazorca y la panícula (incluyendo las mazorcas del maíz) causadas, por ejemplo, por la especie Alternaria, por ejemplo Alternaria spp.; la especie Aspergillus, por ejemplo Aspergillus flavus; la especie Cladosporium, por ejemplo Cladosporium cladosporioides; la especie Claviceps, por ejemplo Claviceps purpurea; la especie Fusarium, por ejemplo Fusarium culmorum; la especie Gibberella, por ejemplo Gibberella zeae; la especie Monographella, por ejemplo Monographella nivalis; la especie Septoria, por ejemplo Septoria nodorum; enfermedades causadas por el hongo del añublo, por ejemplo la especie Sphacelotheca, por ejemplo Sphacelotheca reiliana; la especie Tilletia, por ejemplo Tilletia caries, T. controversa; la especie Urocystis, por ejemplo Urocystis occulta; la especie Ustilago, por ejemplo Ustilago nuda, U. nuda tritici; podredumbre de la fruta causada, por ejemplo, por la especie Aspergillus, por ejemplo Aspergillus flavus; la especie Botrytis, por ejemplo Botrytis cinerea; la especie Penicillium, por ejemplo Penicillium expansum y P. purpurogenum; la especie Sclerotinia, por ejemplo, Sclerotinia sclerotiorum; la especie Verticillium, por ejemplo Verticillium albo-atrum; enfermedades causadas por descomposición y podredumbre de la semilla y el suelo, y además enfermedades de las plántulas causadas, por ejemplo, por la especie Fusarium, por ejemplo, Fusarium culmorum; la especie Phytophthora, por ejemplo Phytophthora cactorum; la especie Pythium, por ejemplo Pythium ultimum; la especie Rhizoctonia, por ejemplo Rhizoctonia solani; la especie Sclerotium, por ejemplo Sclerotium rolfsii; cánceres, agallas y escobas de bruja causadas, por ejemplo, por la especie Nectria, por ejemplo Nectria galligena; marchitamientos causados, por ejemplo, por la especie Monilinia, por ejemplo Monilinia laxa; deformaciones de hojas, flores y frutos causados, por ejemplo, por la especie Taphrina, por ejemplo Taphrina deformans; enfermedades degenerativas de plantas leñosas causadas, por ejemplo, por la especie Esca, por ejemplo Phaemoniella clamydospora y Phaeoacremonium aleophilum y Fomitiporia mediterranea; enfermedades de flores y semillas causadas, por ejemplo, por la especie Botrytis, por ejemplo Botrytis cinerea; enfermedades de tubérculos de planta causadas, por ejemplo, por la especie Rhizoctonia, por ejemplo Rhizoctonia solani; la especie Helminthosporium, por ejemplo Helminthosporium solani; enfermedades causadas por patógenos bacterianos, por ejemplo, la especie Xanthomonas, por ejemplo Xanthomonas campestris pv. oryzae; la especie Pseudomonas, por ejemplo Pseudomonas syringae pv. lachrymans; la especie Erwinia, por ejemplo Erwinia amylovora. Las siguientes enfermedades de soja se pueden combatir con preferencia: enfermedades fúngicas sobre hojas, tallos, capullos y semillas causadas, por ejemplo, por la mancha de la hoja por Alternaria (la especie Alternaria atrans tenuissima), antracnosis (Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum), mancha parda (Septoria glycines), tizón y mancha de la hoja por cercospora (Cercospora kikuchii), tizón de la hoja por choanephora (Choanephora infundibulifera trispora (sin.)), mancha de la hoja por dactuliophora (Dactuliophora glycines), mildiú (Peronospora manshurica), tizón drechslera (Drechslera glycini), manchas redondas en las hojas (Cercospora sojina), manchas foliares por Leptosphaerulina (Leptosphaerulina trifolii), manchas foliares por Phyllosticta (Phyllosticta sojaecola), tizón del capullo y del tallo (Phomopsis sojiae), oidio (Microsphaera diffusa), manchas foliares por Pyrenochaeta (Pyrenochaeta glycines), tizón de los almácigos por Rhizoctonia (Rhizoctonia solani), roya (Phakopsora pachyrhizi, Phakopsora meibomia), sama blanca (Sphaceloma glycines), tizón de la hoja por Stemphylium (Stemphylium botryosum), mancha específica (Corynespora cassicola). Enfermedades fúngicas sobre raíces y la base del tallo causadas, por ejemplo, por podredumbre negra de la raíz (Calonectria crotalariae), podredumbre del carbón (Macrophomina phaseolina), tizón fusarium o marchitamiento, podredumbre de la raíz, y podredumbre del capullo y el cuello (Fusarium oxysporum, Fusarium orthoceras, Fusarium semitectum, Fusarium equiseti), podredumbre de la raíz por Mycoleptodiscus (Mycoleptodiscus terrestris), neocosmospora (Neocosmospora vasinfecta), tizón del tallo y de la vaina (Diaporthe phaseolorum), chancro del tallo (Diaporthe phaseolorum var. caulivora), podredumbre por Phytophthora (Phytophthora megasperma), podredumbre parda del tallo (Phialophora gregata), podredumbre por Pythium (Pythium aphanidermatum, Pythium irregulare, Pythium debaryanum, Pythium myriotylum, Pythium ultimum), podredumbre de la raíz por Rhizoctonia, descomposición del tallo y podredumbres de las semillas (Rhizoctonia solani), descomposición del tallo por esclerotinia (Sclerotinia sclerotiorum), tizón del sur por esclerotinia (Sclerotinia rolfsii), tizón de la raíz por Thielaviopsis (Thielaviopsis basicola).

Los microorganismos capaces de degradar o alterar los materiales técnicos incluyen, por ejemplo, bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. Los principios activos de la invención actúan preferentemente contra los hongos, especialmente mohos, hongos que decoloran la madera y que destruyen la madera (Basidiomycetes), y contra organismos mucilaginosos y algas. Ejemplos incluyen microorganismos de los siguientes géneros: Alternaria, tal como Alternaria tenuis; Aspergillus, tal como Aspergillus niger; Chaetomium, tal como Chaetomium globosum; Coniophora, tal como Coniophora puetana; Lentinus, tal como Lentinus tigrinus; Penicillium, tal como Penicillium glaucum; Polyporus, tal como Polyporus versicolor; Aureobasidium, tal como Aureobasidium pullulans; Sclerophoma, tal como Sclerophoma pityophila; Trichoderma, tal como Trichoderma viride; Escherichia, tal como Escherichia coli; Pseudomonas, tal como Pseudomonas aeruginosa; Staphylococcus, tal como Staphylococcus aureus.

Además, los principios activos de acuerdo con la invención también tienen muy buena actividad antimicótica. Tienen un muy amplio espectro de actividad antimicótica, en particular contra dermatofitos y levaduras, mohos y hongos difásicos (por ejemplo contra la especie *Candida*, tales como *Candida albicans*, *Candida glabrata*), y Epidermophyton floccosum, la

especie *Aspergillus*, tales como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, la especie *Trichophyton*, tal como *Trichophyton mentagrophytes*, la especie *Microsporon* tales como *Microsporon canis* y *audouinii*. La enumeración de estos hongos de ninguna manera constituye una restricción del espectro micótico cubierto que puede ser controlado, y es meramente de carácter ilustrativo.

5 Los principios activos de acuerdo con la invención, por lo tanto, se pueden usar en aplicaciones médicas y no médicas.

En el caso del uso de los principios activos de acuerdo con la invención como fungicidas, las dosis de aplicación pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio, dependiendo del tipo de aplicación. La dosis de aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención es:

- 10 • en el caso del tratamiento de partes de la planta, por ejemplo hojas: de 0,1 a 10 000 g/ha, preferentemente de 10 a 1000 g/ha, más preferentemente de 50 a 300 g/ha (en el caso de aplicación por riego o goteo, es incluso posible reducir la dosis de aplicación, especialmente cuando se usan sustratos inertes tales como lana de roca o perlita);
- en el caso del tratamiento de semillas: de 2 a 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente de 3 a 150 g por 100 kg de semilla, más preferentemente de 2,5 a 25 g por 100 kg de semillas, aún más preferentemente de 2,5 a 12,5 g por 100 kg de semillas;
- 15 • en el caso del tratamiento del suelo: de 0,1 a 10 000 g/ha, preferentemente de 1 a 5000 g/ha.

Estas dosis de aplicación son meramente ilustrativas y no son limitantes para los fines de la invención.

20 Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención por lo tanto se pueden usar para proteger las plantas del ataque de los patógenos mencionados durante un cierto período de tiempo después del tratamiento. El período para el que se proporciona la protección se extiende generalmente de 1 a 28 días, preferentemente durante 1 a 14 días, más preferentemente durante 1 a 10 días, aún más preferentemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los principios activos, o durante hasta 200 días después de un tratamiento de semillas.

25 Además, el tratamiento de acuerdo con la invención puede reducir el contenido de micotoxina en el material cosechado y los alimentos y forrajes preparados a partir de los mismos. Las micotoxinas incluyen particularmente, pero no de forma exclusiva, lo siguiente: deoxinivalenol (DON), nivalenol, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, toxina T2 y HT2, fumonisinas, zearalenon, moniliformina, fusarina, diacetoxiscirpenol (DAS), beauvericina, enniatina, fusaroproliferina, fusarenol, ocratoxinas, patulina, alcaloides del comezuelo del centeno y aflatoxinas que se pueden producir, por ejemplo, por los siguientes hongos: la especie *Fusarium*, tales como *Fusarium acuminatum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikuroi*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides*, entre otros, y además por la especie *Aspergillus*, la especie *Penicillium*, *Claviceps purpurea*, la especie *Stachybotrys*, entre otros.

35 Si fuera apropiado, los compuestos de acuerdo con la invención pueden, en ciertas concentraciones o dosis de aplicación, usarse además como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos tipo micoplasma) y RLO (organismos tipo rickettsia). De ser apropiado, además se pueden usar como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Los ejemplos que siguen ilustran la invención en detalle.

A. Ejemplos químicos

40 1. Preparación de N-(cianometil)-3-(3,5-diclorofenil)-5-metoxi-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carboxamida (ejemplo 1.20-40)

Intermedio 1: 3,5-diclorobenzaldehído oxima

45 23,82 g (342,8 mmol) de clorhidrato de hidroxilamina se mezclaron con 80 ml de etanol. Después de la adición de 28,12 g (342,8 mmol) de acetato de sodio, se agregó gota a gota una solución de 50,00 g (285,7 mmol) de 3,5-diclorobenzaldehído en 100 ml de etanol dentro de 30 min, y la mezcla se dejó agitar durante 2 h y posteriormente se dejó asentar durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró completamente, después se añadieron 500 ml de CH_2Cl_2 , y la mezcla se lavó con 400 ml de agua. La fase acuosa se lavó una vez con 100 ml de CH_2Cl_2 y la fase orgánica se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró y se concentró. El residuo se usó sin purificación posterior. Rendimiento: 56,50 g (98 %) RMN de ^1H (CDCl_3): $\sigma = 7,36$ (s, 1H, Ar-H), 7,47 (s, 2H, Ar-H), 7,63 (s a, 1H, OH), 8,02 (s, 1H, HC=NOH).

Intermedio 2: Cloruro de 3,5-dicloro-N-hidroxibencenocarboximidoilo

Se dispusieron 30,00 g (157,9 mmol) de 3,5-diclorobenzaldehído oxima en 379 ml de HCl 0,5 M en DMF, y se añadieron 116,7 g (189,5 mmol) de oxona (peroxomonosulfato de potasio) en porciones a temperatura ambiente (TA). A fin de que la mezcla de reacción no se calentase hasta una temperatura interna de más de 50 °C, se enfrió

con un baño helado. Después de 2 h, la solución de reacción se vertió en 1 l de agua helada y se extrajo dos veces con 500 ml de éter cada vez. Las fases orgánicas combinadas se lavaron posteriormente con 400 ml de HCl acuoso 0,5 M y con 200 ml de solución de NaCl saturada, se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró. El residuo se usó sin purificación posterior. Rendimiento: 28,40 g (80 %)

5 RMN de ¹H (CDCl₃): σ = 7,43 (s, 1H, Ar-H), 7,74 (s, 2H, Ar-H), 8,03 (s a, 1H, OH).

Intermedio 3: 3-(3,5-diclorofenil)-5-metoxi-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carboxilato de metilo (ejemplo A-116)

Se disolvieron 35,00 g (155,9 mmol) en 490 ml de 2-propanol, y se añadieron 31,61 g (171,5 mmol) de 2-metoxiacrilato de metilo. A TA, se añadieron 65,49 g (779,6 mmol) de NaHCO₃ a esta solución, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 h. Los sólidos se filtraron posteriormente, y el filtrado se concentró sobre un rotavapor. El producto bruto se disolvió en diclorometano, se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró. A

10 continuación, los sólidos se disolvieron en un poco de diclorometano, y se añadió isopropanol. El producto cristalizó en esta mezcla de disolventes. Rendimiento: 28,0 g (59 %)

RMN de ¹H (CDCl₃): σ = 3,40 (d H_A de AB, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 3,48 (s, 3H, O-CH₃), 3,78 (d, H_B de AB, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 3,90 (s, 3H, OCH₃), 7,43 (s, 1H, Ar-H), 7,55 (s, 2H, Ar-H).

15 Intermedio 4: Ácido 3-(3,5-diclorofenil)-5-metoxi-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carboxílico (ejemplo A-115)

Se disolvieron 40,00 g (131,5 mmol) de 3-(3,5-diclorofenil)-5-metoxi-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carboxilato de metilo en 800 ml de THF, y posteriormente se añadieron 2,99 g de LiOH de forma gradual en forma de una solución 0,5 M en agua. Después de agitar a TA durante 2 h, el disolvente de THF se eliminó al vacío, se añadieron 200 ml de una solución de NaHCO₃ semisaturada y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. Posteriormente, la fase acuosa se

20 mezcló con 300 ml de cloruro de metileno y luego se ajustó hasta pH 1 por adición gradual de HCl 0,5 N mientras se agitaba. La fase orgánica se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró. Rendimiento: 35,4 g (88 %)

RMN de ¹H (CDCl₃): σ = 3,45 (d H_A de AB, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 3,51 (s, 3H, OCH₃), 3,85 (d H_B de AB, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 7,45 (s, 1H, Ar-H), 7,56 (s, 2H, Ar-H), 9,3 (s a, 1H, COOH).

Ejemplo 1.20-40.

25 N-(cianometil)-3-(3,5-diclorofenil)-5-metoxi-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carboxamida Se dispusieron 200 mg (0,689 mmol) de ácido 3-(3,5-diclorofenil)-5-metoxi-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carboxílico en 10 ml de diclorometano, y 93 mg (0,69 mmol) de HOBT y se añadieron 57 mg (1,0 mmol) de 2-aminoacetoniitrilo. Posteriormente, se añadieron 172 mg (0,896 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y la mezcla se agitó durante 30 min. Para el procesamiento, la mezcla se lavó con agua y se cromatógrafió usando gel de sílice con heptano/acetato de

30 etilo. Rendimiento: 220 mg (92 %).
RMN de ¹H (CDCl₃): σ = 3,36 (d H_A de AB, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 3,37 (s, 3H, OCH₃), 3,81 (d H_B de AB, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 4,27 (d AB, 2H; J AB = 16 Hz, JAC = 7Hz, 2H, NH-C-CH_AH_B); 7,17 (t a, J=7Hz, 1H, NH); 7,45 (s, 1H, Ar-H), 7,56 (s, 2H, Ar-H).

Intermedio 5

35 2,2-dimetoxipropanoato de metilo

Se mezclaron 100 g (979 mmol) de 2-oxopropanoato de metilo con 135 g (1273 mmol) de ortoformiato de trimetilo en 240 ml de metanol. Después de la adición de 0,96 g (9,79 mmol) de H₂SO₄ concentrado, la mezcla se calentó a reflujo durante 4 h. El disolvente se destiló en el transcurso de 2 h y el producto bruto se enfrió hasta 10 °C y se

40 añadió a una solución de 2,4 g de KOH en 1200 ml de agua a 10 °C. Después de la extracción repetida con éter dietílico, el producto se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró. El residuo se destiló nuevamente. P. e. (10 mbar): 50-55 °C. Rendimiento: 118 g (77 %)

RMN de ¹H (CDCl₃): σ = 1,53 (s, 3H, C-CH₃), 3,29 (s, 6H, CH₃-O-C-O-CH₃), 3,82 (s, 3H, COOCH₃).

Intermedio 6

2-metoxiacrilato de metilo

45 Se dispusieron 100 g (675 mmol) de 2,2-dimetoxipropanoato de metilo en 300 ml de DMF, se añadieron 52,7 g (371 mmol) de P₂O₅ en porciones mientras se agitaba y luego la mezcla se calentó hasta 100 °C durante 1 h. La solución de reacción se añadió posteriormente a 1 l de solución de NaHCO₃ saturada enfriada a 10 °C. Esta solución se extrajo con éter dietílico y los extractos orgánicos se lavaron tres veces con solución de NaCl saturada, se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El producto se usó sin purificación posterior. Rendimiento: 66,0 g (81 %)

50 RMN de ¹H (CDCl₃): σ = 3,67 (s, 3H, C-CH₃), 3,83 (s, 3H, COOCH₃), 4,63 (d, 1H, J=3Hz, C=CHH), 5,37 (d, 1H, J=3Hz, C=CHH).

Intermedio 7

2-etoxiacrilato de etilo

Síntesis análoga al intermedio 6.

5 RMN de ^1H (CDCl_3) : $\sigma = 1,33$ (t, 3H, $\text{J}=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$), 1,40 (t, 3H, $\text{J}=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$) 3,83 (c, 2H, $\text{J}=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$), 4,27 (c, 2H, $\text{J}=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$), 4,58 (d, 1H, $\text{J}=3\text{Hz}$, $\text{C}=\text{CHH}$), 5,32 (d, 1H, $\text{J}=3\text{Hz}$, $\text{C}=\text{CHH}$).

Ejemplo 3.11-9.

3-(3,5-difluorofenil)-5-metoxi-N-(2,2,2-trifluoroetil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carbotioamida

10 Se disolvieron 400 mg (1,182 mmol) de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metoxi-N-(2,2,2-trifluoroetil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-carbotioamida en 20 ml de THF, y se agregó un total de 478 mg (1,182 mmol) de reactivo de Lawesson en porciones. Posteriormente, la solución transparente se calentó hasta 80°C en un microondas durante 2 h. El disolvente se eliminó al vacío y el residuo se suspendió en acetato de etilo y se extrajo con solución de cloruro de sodio saturada. La fase orgánica se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró y se concentró. Esto fue seguido por la purificación cromatográfica con acetato de etilo/n-heptano usando gel de sílice. Rendimiento: 150 mg (34 %)

15 RMN de ^1H (CDCl_3) : $\sigma = 3,41$ (s, 3H, $\text{O}-\text{CH}_3$); 3,57 (d H_A de AB, $\text{J} = 19$ Hz, 1H, $\text{N}=\text{C}-\text{CH}_A\text{H}_B$), 4,07 (d H_B de AB, $\text{J} = 19$ Hz, 1H, $\text{N}=\text{C}-\text{CH}_A\text{H}_B$), 4,26-4,41 (m, 1H, $\text{CHH}-\text{CF}_3$); 4,54-4,71 (m, 1H, $\text{CHH}-\text{CF}_3$); 6,92 (tt, 1H, fenil-4H); 7,21 (d, 2H, Ar-2, 6H); 8,70 (s a, 1H, NH).

20 De forma análoga a la preparación de los compuestos anteriormente mencionados y de acuerdo con los detalles generales de la preparación, se pueden obtener los compuestos especificados en las siguientes tablas. Los datos de RMN de los ejemplos desvelados en estas tablas se presentan en la forma (valores δ , número de átomos de H, división de multiplete). Los pares de números de valor δ de intensidad de señal para diferentes picos de señal se enumeran separados entre sí por punto y coma.

Tabla 1.1: compuestos de acuerdo con la invención 1.1-1 a 1.1-266 de la fórmula general (1.1) en la que A-X es como se define a continuación.

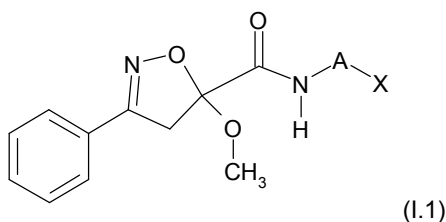


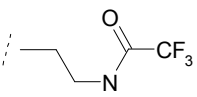
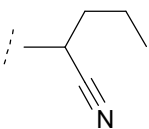
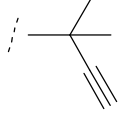
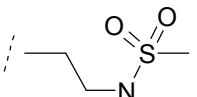
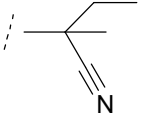
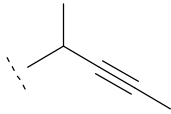
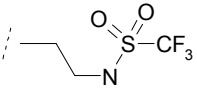
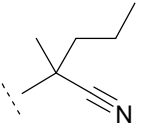
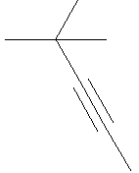
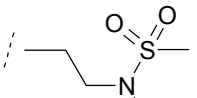
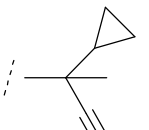
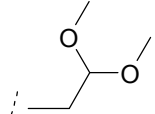
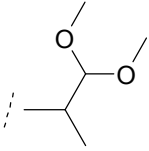
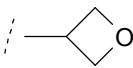
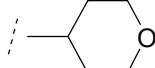
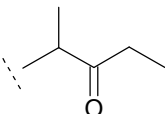
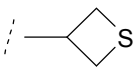
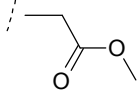
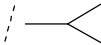

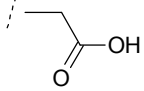
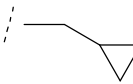
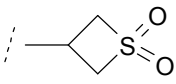
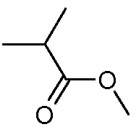
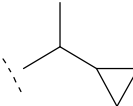
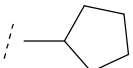
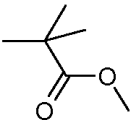
Tabla 1.1:

n.º	—A—X	n.º	—A—X	n.º	—A—X
1.1-1	—H	1.1-10	$-\text{CH}_2\text{CHF}_2$	1.1-19	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
1.1-2	— CH_3	1.1-11	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	1.1-20	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$
1.1-3	$-\text{CH}_2\text{CH}_2$	1.1-12	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{CF}_3)_2$	1.1-21	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
1.1-4	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	1.1-13	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	1.1-22	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$
1.1-5	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	1.1-14	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$	1.1-23	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_3$

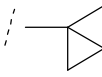
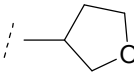
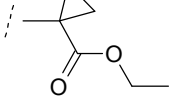
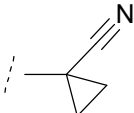
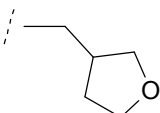
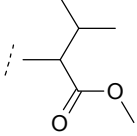
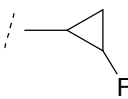
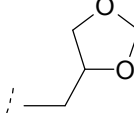
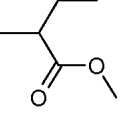
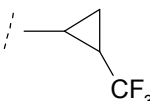
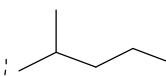
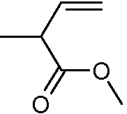
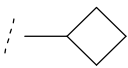
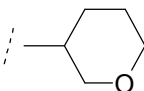
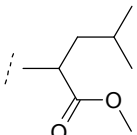
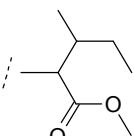
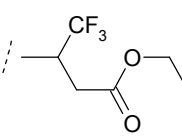
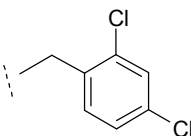
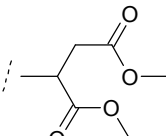
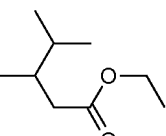
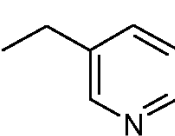
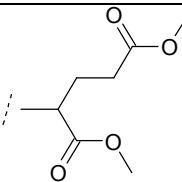
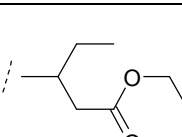
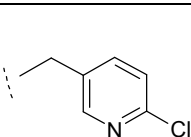
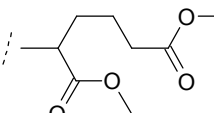
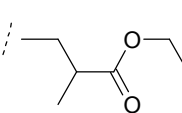
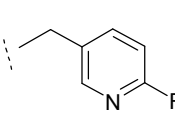
(continuación)

1.1-6		1.1-15		1.1-24	
1.1-7		1.1-16		1.1-25	
1.1-8		1.1-17		1.1-26	
n.º		n.º		n.º	
1.1-9		1.1-18		1.1-27	
1.1-28		1.1-38		1.1-48	
1.1-29		1.1-39		1.1-49	
1.1-30		1.1-40		1.1-50	
1.1-31		1.1-41		1.1-51	
1.1-32		1.1-42		1.1-52	
1.1-33		1.1-43		1.1-53	

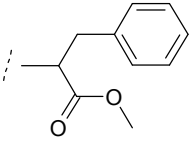
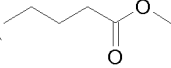
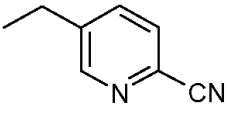
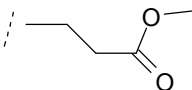
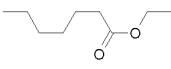
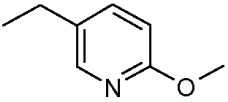
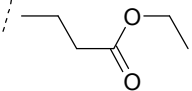
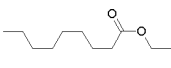
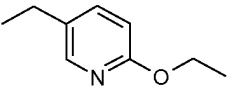
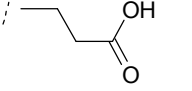
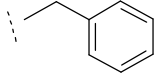
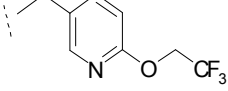
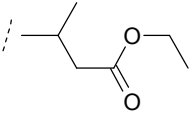
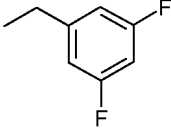
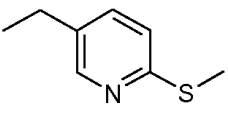
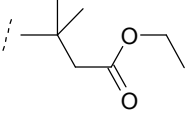
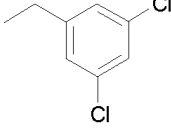
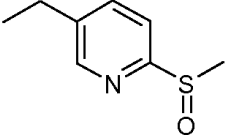
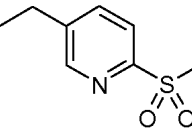
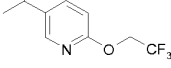
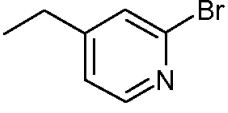
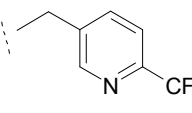
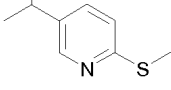
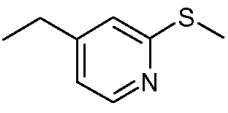
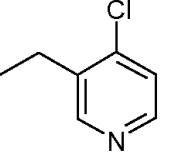
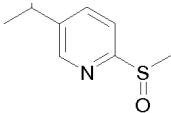
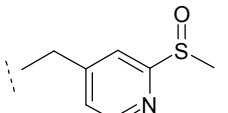
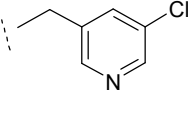
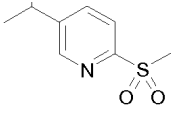
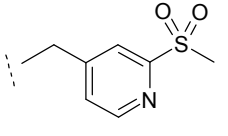
(continuación)

1.1-34		1.1-44		1.1-54	
1.1-35		1.1-45		1.1-55	
1.1-36		1.1-46		1.1-56	
1.1-37		1.1-47		1.1-57	
1.1-58		1.1-68		1.1-78	
1.1-59		1.1-69		1.1-79	
1.1-60		1.1-70		1.1-80	
1.1-61		1.1-71		1.1-81	
1.1-62		1.1-72		1.1-82	

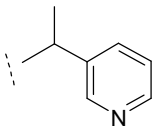
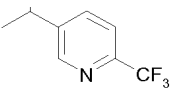
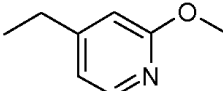
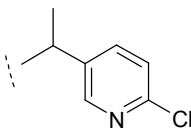
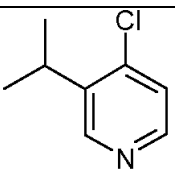
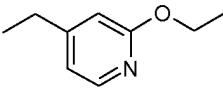
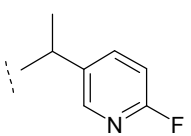
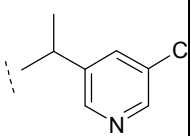
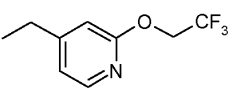
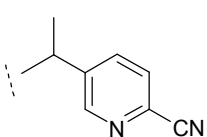
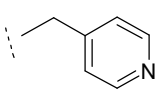
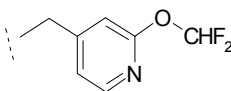
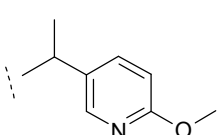
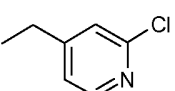
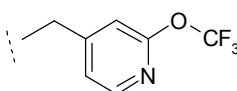
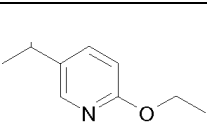
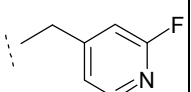
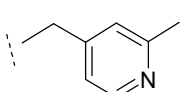
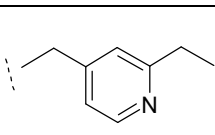
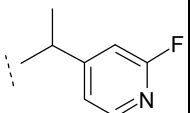
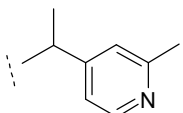
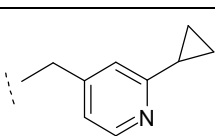
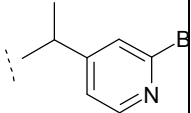
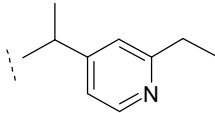
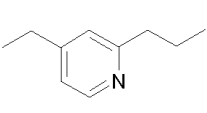
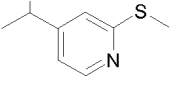
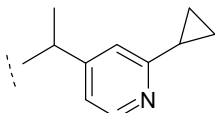
(continuación)

1.1-63		1.1-73		1.1-83	
1.1-64		1.1-74		1.1-84	
1.1-65		1.1-75		1.1-85	
1.1-66		1.1-76		1.1-86	
1.1-67		1.1-77		1.1-87	
1.1-88		1.1-98		1.1-108	
1.1-89		1.1-99		1.1-109	
1.1-90		1.1-100		1.1-110	
1.1-91		1.1-101		1.1-111	

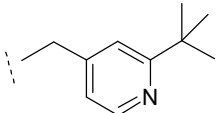
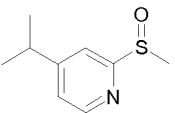
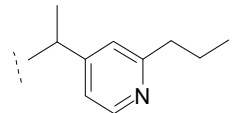
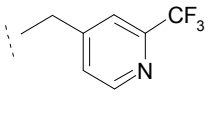
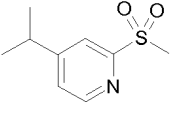
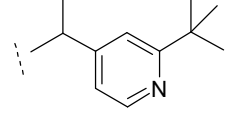
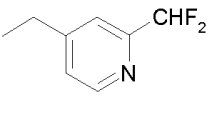
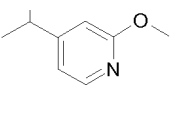
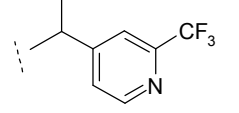
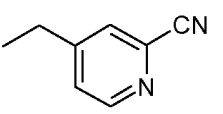
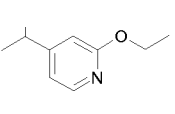
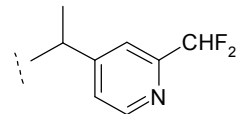
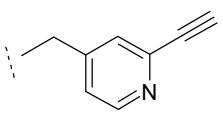
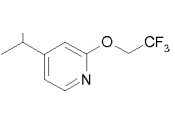
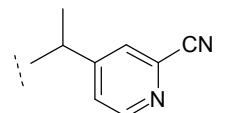
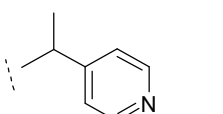
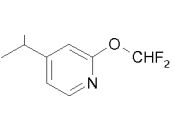
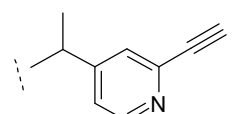
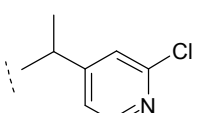
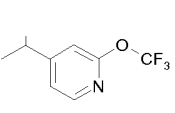
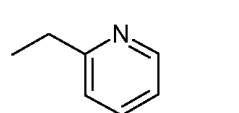
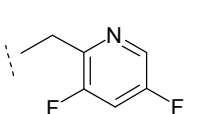
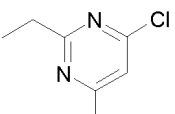
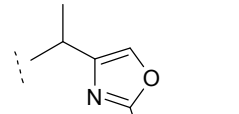
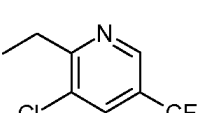
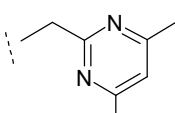
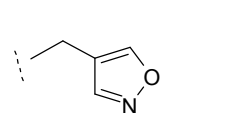
(continuación)

1.1-92		1.1-102		1.1-112	
1.1-93		1.1-103		1.1-113	
1.1-94		1.1-104		1.1-114	
1.1-95		1.1-105		1.1-115	
1.1-96		1.1-106		1.1-116	
1.1-97		1.1-107		1.1-117	
1.1-118		1.1-128		1.1-138	
1.1-119		1.1-129		1.1-139	
1.1-120		1.1-130		1.1-140	
1.1-121		1.1-131		1.1-141	

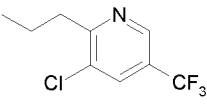
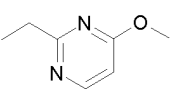
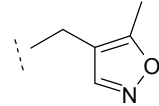
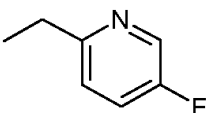
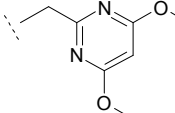
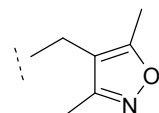
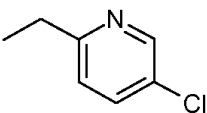
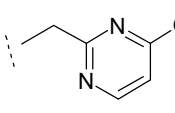
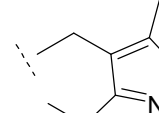
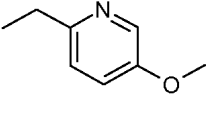
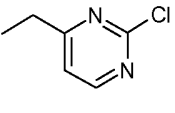
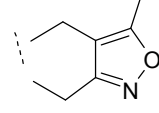
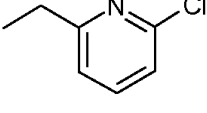
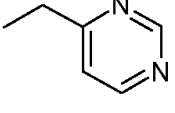
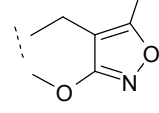
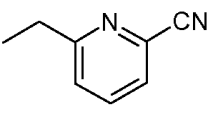
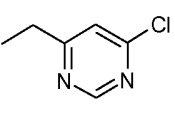
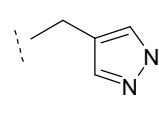
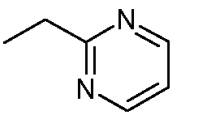
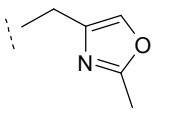
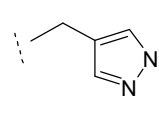
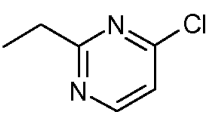
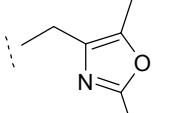
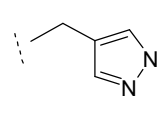
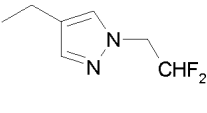
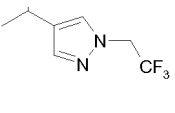
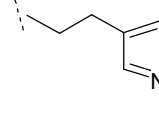
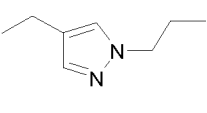
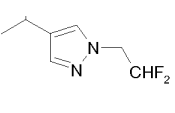
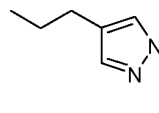
(continuación)

1.1-122		1.1-132		1.1-142	
1.1-123		1.1-133		1.1-143	
1.1-124		1.1-134		1.1-144	
1.1-125		1.1-135		1.1-145	
1.1-126		1.1-136		1.1-146	
1.1-127		1.1-137		1.1-147	
1.1-148		1.1-158		1.1-168	
1.1-149		1.1-159		1.1-169	
1.1-150		1.1-160		1.1-170	

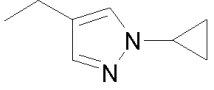
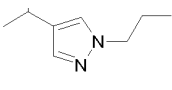
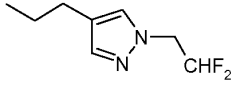
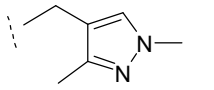
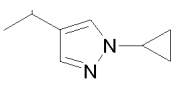
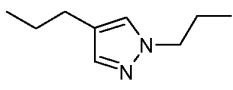
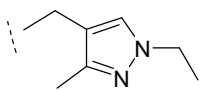
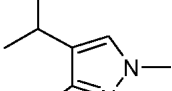
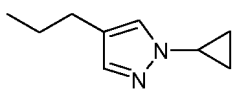
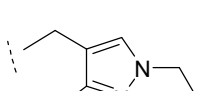
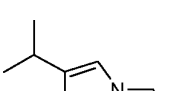
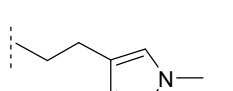
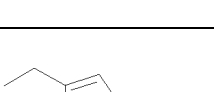
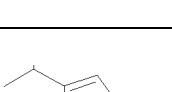
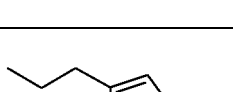
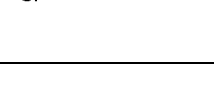
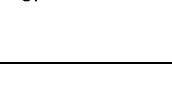
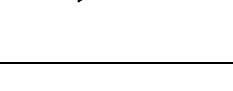
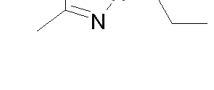
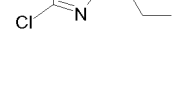
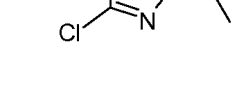
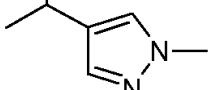
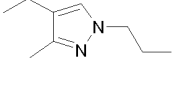
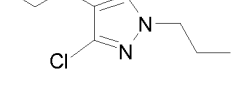
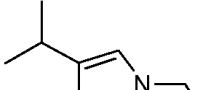
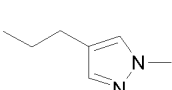
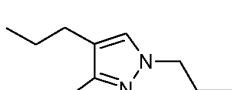
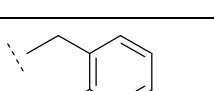
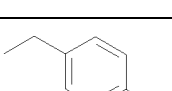
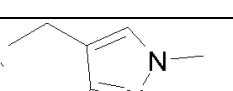
(continuación)

1.1-151		1.1-161		1.1-171	
1.1-152		1.1-162		1.1-172	
1.1-153		1.1-163		1.1-173	
1.1-154		1.1-164		1.1-174	
1.1-155		1.1-165		1.1-175	
1.1-156		1.1-166		1.1-176	
1.1-157		1.1-167		1.1-177	
1.1-178		1.1-188		1.1-198	
1.1-179		1.1-189		1.1-199	

(continuación)

1.1-180		1.1-190		1.1-200	
1.1-181		1.1-191		1.1-201	
1.1-182		1.1-192		1.1-202	
1.1-183		1.1-193		1.1-203	
1.1-184		1.1-194		1.1-204	
1.1-185		1.1-195		1.1-205	
1.1-186		1.1-196		1.1-206	
1.1-187		1.1-197		1.1-207	
1.1-208		1.1-218		1.1-228	
1.1-209		1.1-219		1.1-229	

(continuación)

1.1-210		1.1-220		1.1-230	
1.1-211		1.1-221		1.1-231	
1.1-212		1.1-222		1.1-232	
1.1-213		1.1-223		1.1-233	
1.1-214		1.1-224		1.1-234	
1.1-215		1.1-225		1.1-235	
1.1-216		1.1-226		1.1-236	
1.1-217		1.1-227		1.1-237	
1.1-238		1.1-248		1.1-258	
1.1-239		1.1-249		1.1-259	

(continuación)

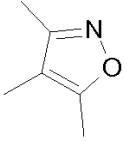
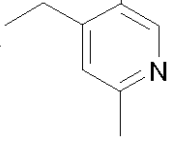
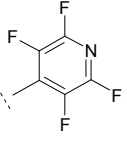
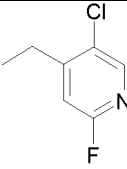
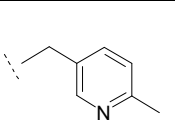
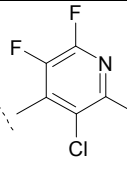
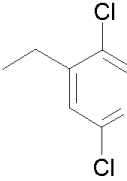
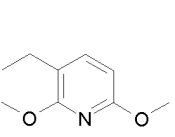
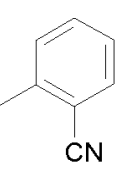
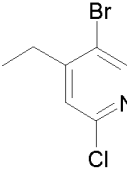
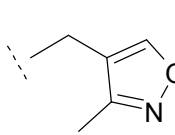
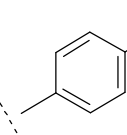
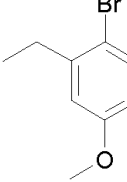
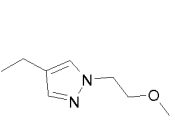
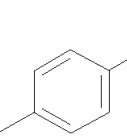
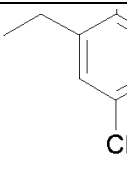
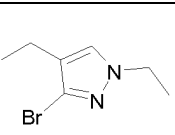
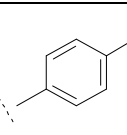
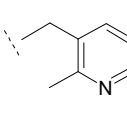
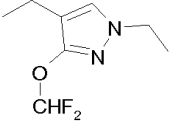
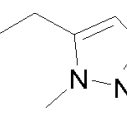
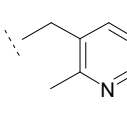
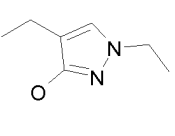
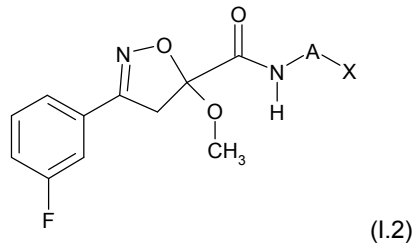
1.1-240		1.1-250		1.1-260	
1.1-241		1.1-251		1.1-261	
1.1-242		1.1-252		1.1-262	
1.1-243		1.1-253		1.1-263	
1.1-244		1.1-254		1.1-264	
1.1-245		1.1-255		1.1-265	
1.1-246		1.1-256		1.1-266	
1.1-247		1.1-257			

Tabla 1.2: compuestos de acuerdo con la invención 1.2-1 a 1.2-266 de la fórmula general (1.2) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.3: compuestos de acuerdo con la invención 1.3-1 a 1.3-266 de la fórmula general (1.3) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

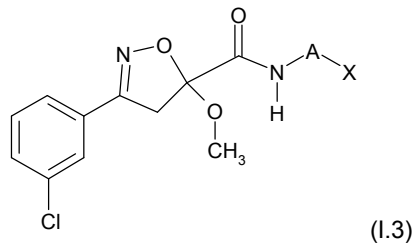
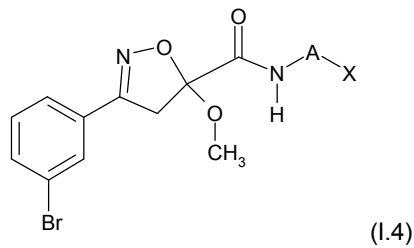


Tabla 1.4: compuestos de acuerdo con la invención 1.4-1 a 1.4-266 de la fórmula general (1.4) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.5: compuestos de acuerdo con la invención 1.5-1 a 1.5-266 de la fórmula general (1.5) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

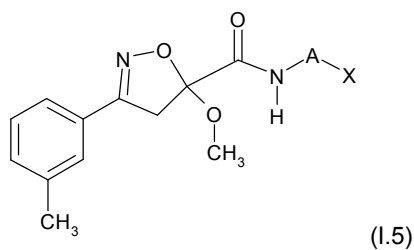


Tabla 1.6: compuestos de acuerdo con la invención 1.6-1 a 1.6-266 de la fórmula general (1.6) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

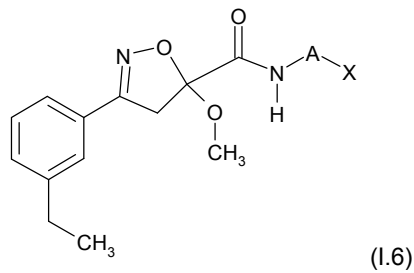
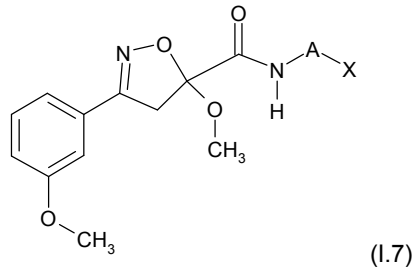


Tabla 1.7: compuestos de acuerdo con la invención 1.7-1 a 1.7-266 de la fórmula general (I.7) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.8: compuestos de acuerdo con la invención 1.8-1 a 1.8-266 de la fórmula general (I.8) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

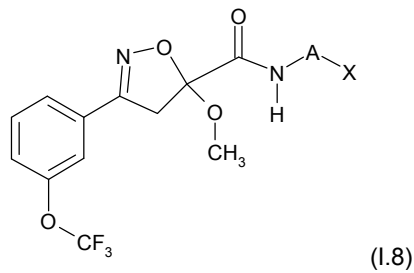
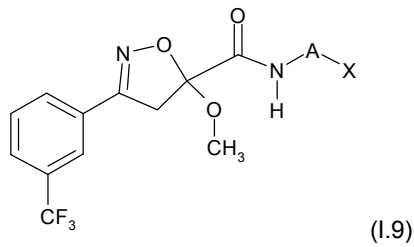


Tabla 1.9: compuestos de acuerdo con la invención 1.9-1 a 1.9-266 de la fórmula general (I.9) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.10: compuestos de acuerdo con la invención 1.10-1 a 1.10-266 de la fórmula general (I.10) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

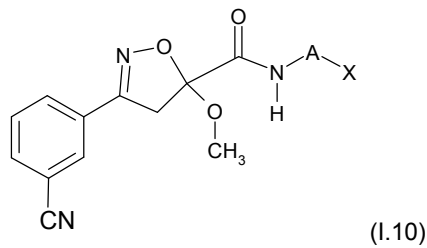


Tabla 1.11: compuestos de acuerdo con la invención 1.11-1 a 1.11-266 de la fórmula general (I.11) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

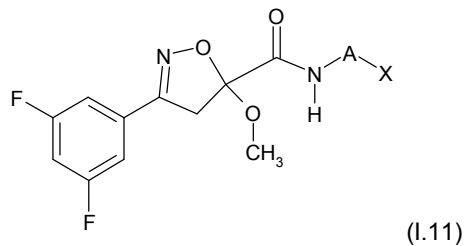
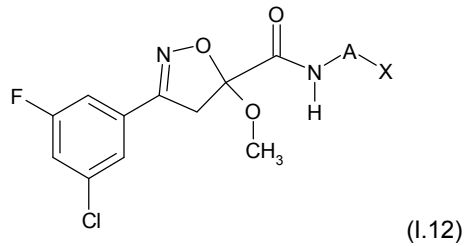


Tabla 1.12: compuestos de acuerdo con la invención 1.12-1 a 1.12-266 de la fórmula general (I.12) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.13: compuestos de acuerdo con la invención 1.13-1 a 1.13-266 de la fórmula general (I.13) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

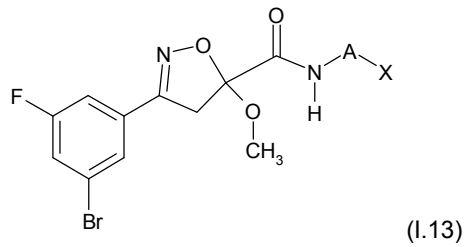
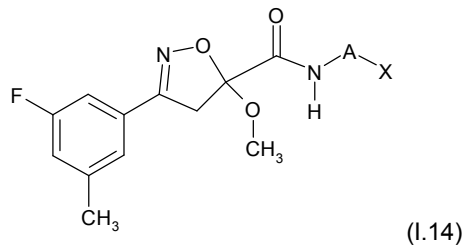


Tabla 1.14: compuestos de acuerdo con la invención 1.14-1 a 1.14-266 de la fórmula general (I.14) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.15: compuestos de acuerdo con la invención 1.15-1 a 1.15-266 de la fórmula general (I.15) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

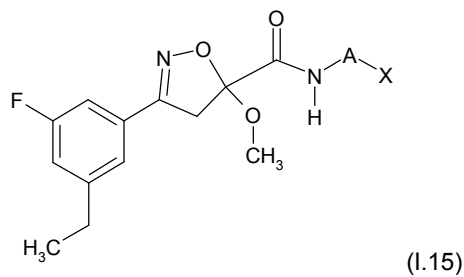


Tabla 1.16: compuestos de acuerdo con la invención 1.16-1 a 1.16-266 de la fórmula general (I.16) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

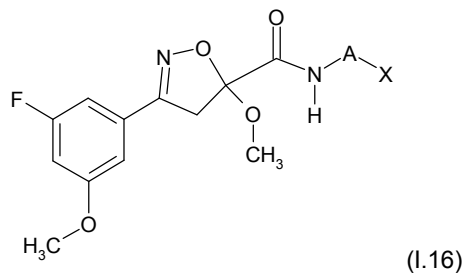
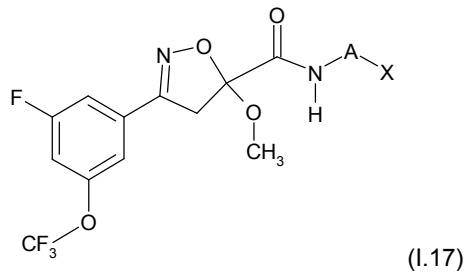


Tabla 1.17: compuestos de acuerdo con la invención 1.17-1 a 1.17-266 de la fórmula general (I.17) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.18: compuestos de acuerdo con la invención 1.18-1 a 1.18-266 de la fórmula general (I.18) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

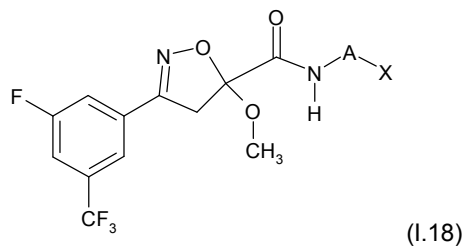
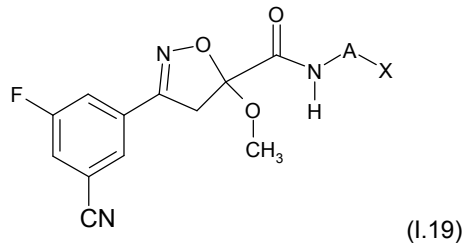


Tabla 1.19: compuestos de acuerdo con la invención 1.19-1 a 1.19-266 de la fórmula general (I.19) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.20: compuestos de acuerdo con la invención 1.20-1 a 1.20-266 de la fórmula general (I.20) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

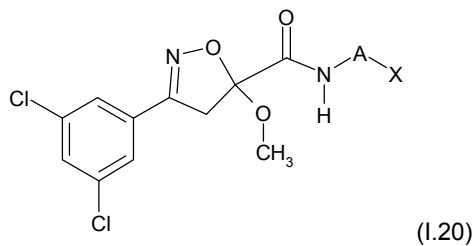


Tabla 1.21: compuestos de acuerdo con la invención 1.21-1 a 1.21-266 de la fórmula general (I.21) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

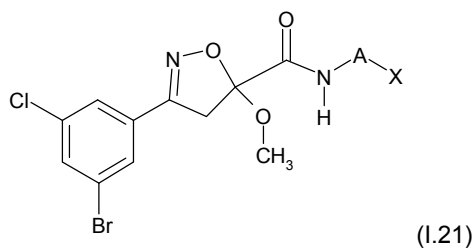
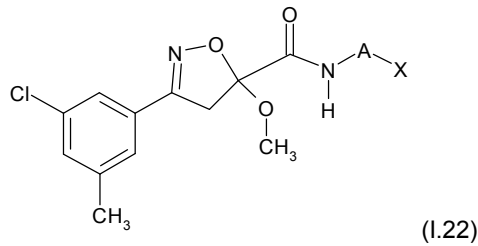


Tabla 1.22: compuestos de acuerdo con la invención 1.22-1 a 1.22-266 de la fórmula general (I.22) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.23: compuestos de acuerdo con la invención 1.23-1 a 1.23-266 de la fórmula general (I.23) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

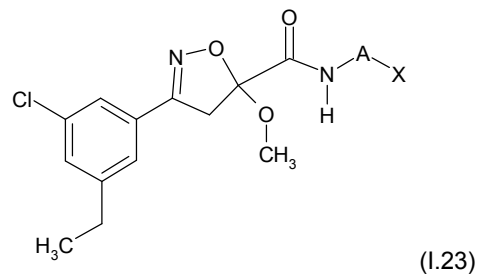
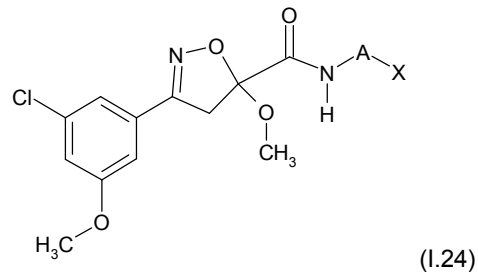


Tabla 1.24: compuestos de acuerdo con la invención 1.24-1 a 1.24-266 de la fórmula general (I.24) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.25: compuestos de acuerdo con la invención 1.25-1 a 1.25-266 de la fórmula general (I.25) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

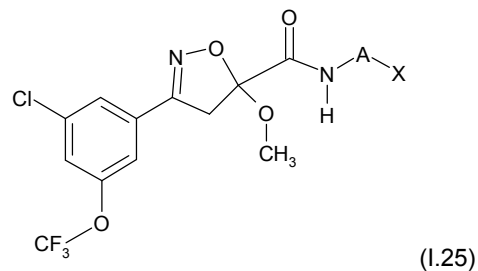


Tabla 1.26: compuestos de acuerdo con la invención 1.26-1 a 1.26-266 de la fórmula general (I.26) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

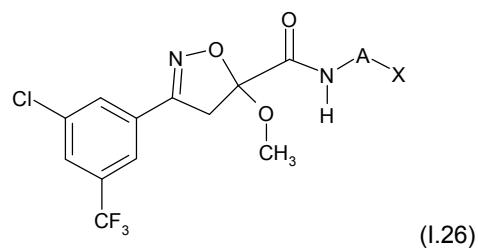
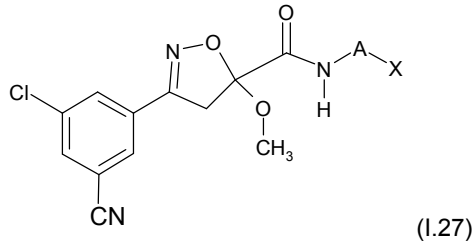


Tabla 1.27: compuestos de acuerdo con la invención 1.27-1 a 1.27-266 de la fórmula general (I.27) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.28: compuestos de acuerdo con la invención 1.28-1 a 1.28-266 de la fórmula general (I.28) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

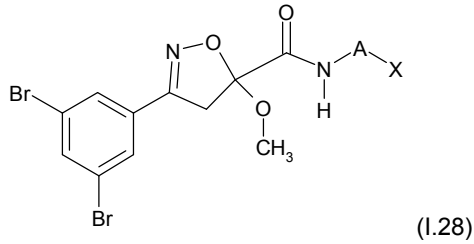
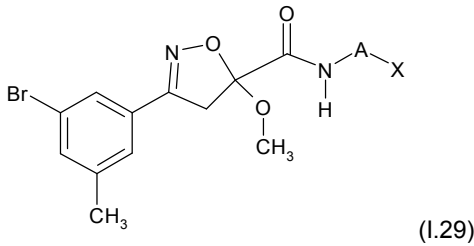


Tabla 1.29: compuestos de acuerdo con la invención 1.29-1 a 1.29-266 de la fórmula general (I.29) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.30: compuestos de acuerdo con la invención 1.30-1 a 1.30-266 de la fórmula general (I.30) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

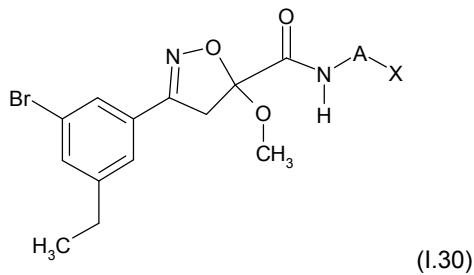


Tabla 1.31: compuestos de acuerdo con la invención 1.31-1 a 1.31-266 de la fórmula general (I.31) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

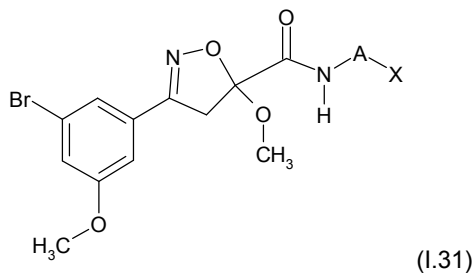
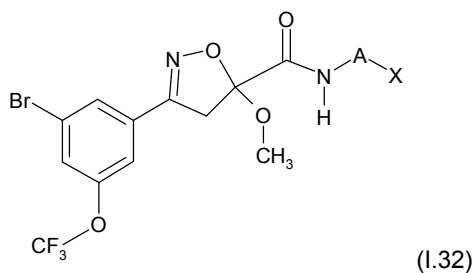


Tabla 1.32: compuestos de acuerdo con la invención 1.32-1 a 1.32-266 de la fórmula general (I.32) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.33: compuestos de acuerdo con la invención 1.33-1 a 1.33-266 de la fórmula general (I.33) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

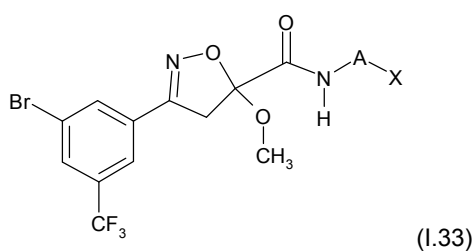
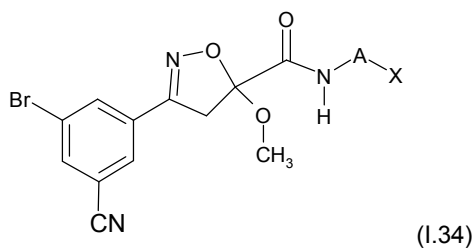


Tabla 1.34: compuestos de acuerdo con la invención 1.34-1 a 1.34-266 de la fórmula general (I.34) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.35: compuestos de acuerdo con la invención 1.35-1 a 1.35-266 de la fórmula general (I.35) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

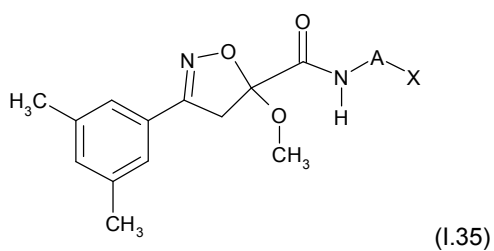


Tabla 1.36: compuestos de acuerdo con la invención 1.36-1 a 1.36-266 de la fórmula general (I.36) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

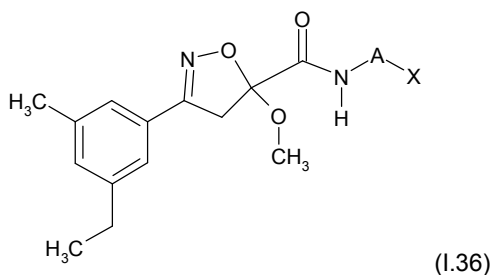
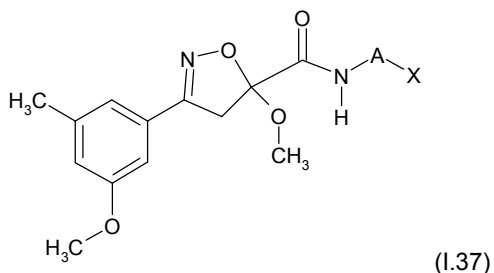


Tabla 1.37: compuestos de acuerdo con la invención 1.37-1 a 1.37-266 de la fórmula general (I.37) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.38: compuestos de acuerdo con la invención 1.38-1 a 1.38-266 de la fórmula general (I.38) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

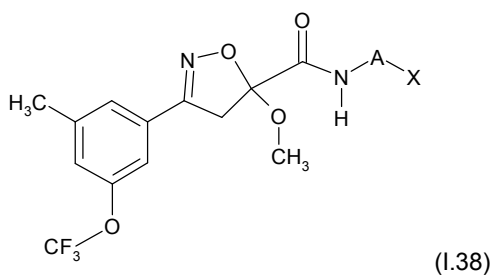
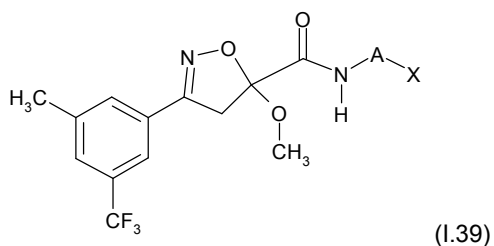


Tabla 1.39: compuestos de acuerdo con la invención 1.39-1 a 1.39-266 de la fórmula general (I.39) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.40: compuestos de acuerdo con la invención 1.41-1 a 1.41-266 de la fórmula general (I.41) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

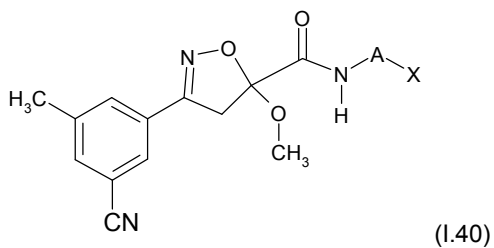


Tabla 1.41: compuestos de acuerdo con la invención 1.41-1 a 1.41-266 de la fórmula general (I.41) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

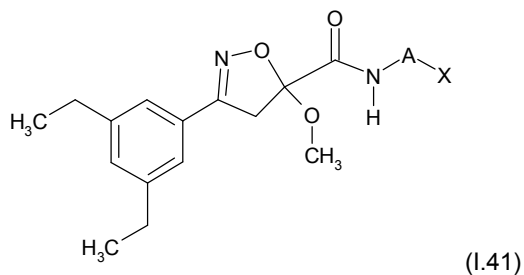
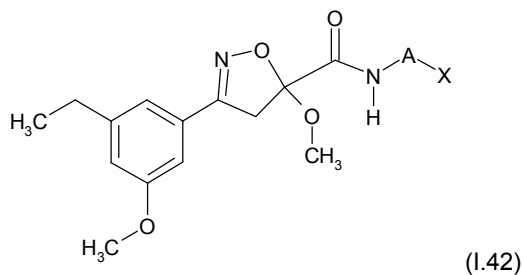


Tabla 1.42: compuestos de acuerdo con la invención 1.42-1 a 1.42-266 de la fórmula general (I.42) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.43: compuestos de acuerdo con la invención 1.43-1 a 1.43-266 de la fórmula general (I.43) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

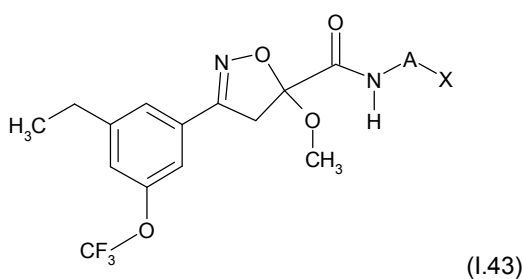
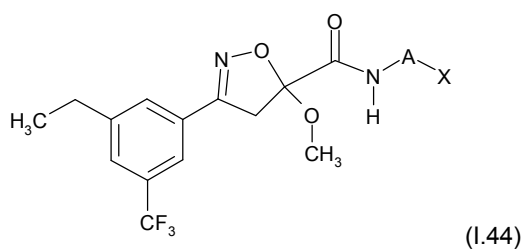


Tabla 1.44: compuestos de acuerdo con la invención 1.44-1 a 1.44-266 de la fórmula general (I.44) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.45: compuestos de acuerdo con la invención 1.45-1 a 1.45-266 de la fórmula general (I.45) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

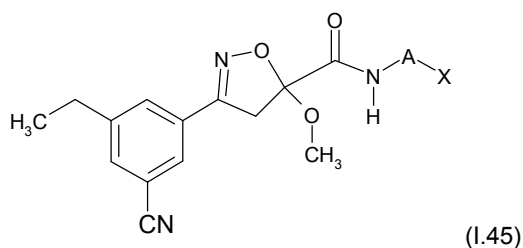


Tabla 1.46: compuestos de acuerdo con la invención 1.46-1 a 1.46-266 de la fórmula general (I.46) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

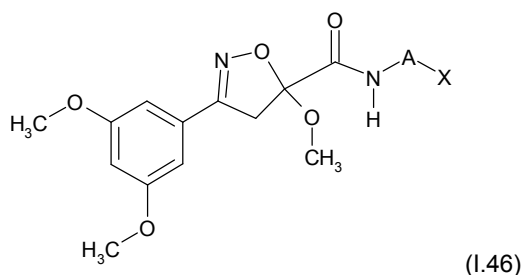
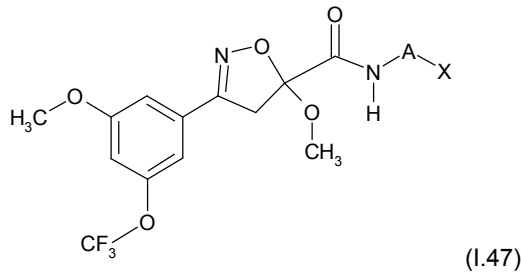


Tabla 1.47: compuestos de acuerdo con la invención 1.47-1 a 1.47-266 de la fórmula general (I.47) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.48: compuestos de acuerdo con la invención 1.48-1 a 1.48-266 de la fórmula general (I.48) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

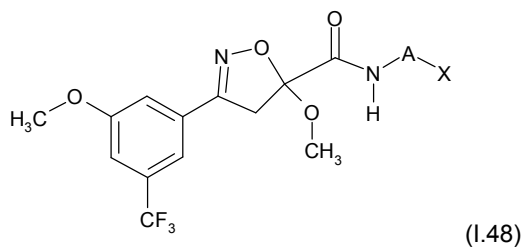
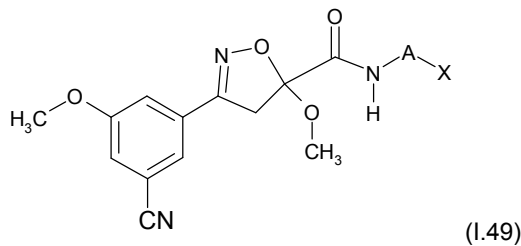


Tabla 1.49: compuestos de acuerdo con la invención 1.49-1 a 1.49-266 de la fórmula general (I.49) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.50: compuestos de acuerdo con la invención 1.50-1 a 1.50-266 de la fórmula general (I.50) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

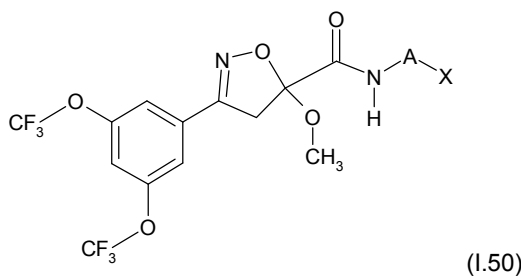


Tabla 1.51: compuestos de acuerdo con la invención 1.51-1 a 1.51-266 de la fórmula general (I.51) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

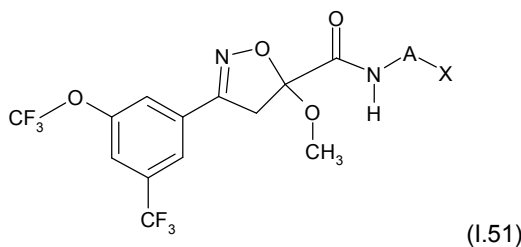
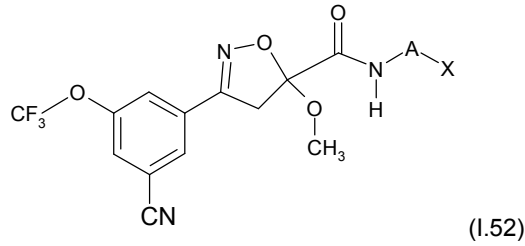


Tabla 1.52: compuestos de acuerdo con la invención 1.52-1 a 1.52-266 de la fórmula general (1.52) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 Tabla 1.53: compuestos de acuerdo con la invención 1.53-1 a 1.53-266 de la fórmula general (1.53) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

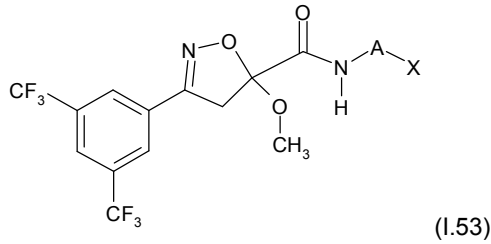
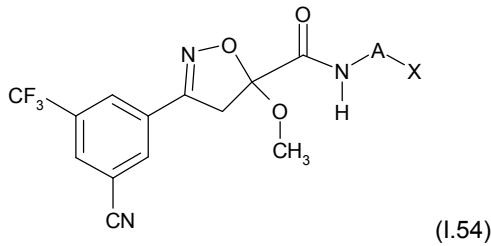


Tabla 1.54: compuestos de acuerdo con la invención 1.54-1 a 1.54-266 de la fórmula general (1.54) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



10 Tabla 1.55: compuestos de acuerdo con la invención 1.55-1 a 1.55-266 de la fórmula general (1.55) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

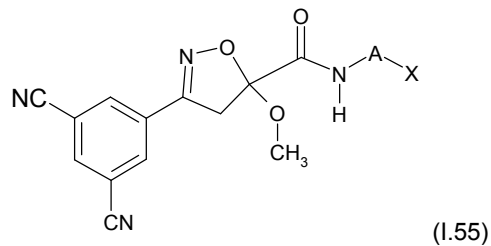


Tabla 1.56: compuestos de acuerdo con la invención 1.56-1 a 1.56-266 de la fórmula general (1.56) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.

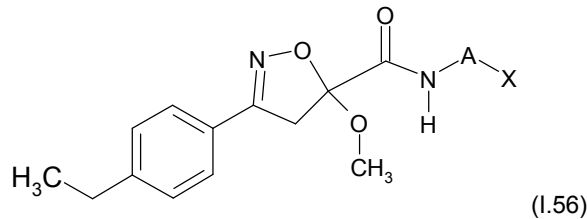
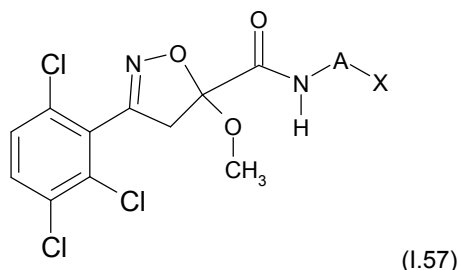


Tabla 1.57: compuestos de acuerdo con la invención 1.57-1 a 1.57-266 de la fórmula general (1.57) en la que A-X es como se define en la tabla 1.1.



5 De forma análoga a los compuestos de acuerdo con la invención especificados en las tablas 1.1 a 1.57 resultan de forma correspondiente los compuestos de acuerdo con la invención de las tablas 2.1 a 2.57 en las que Y se refiere a oxígeno, R³ se refiere a etilo y los otros sustituyentes tienen en cada caso los significados indicados en las tablas 1.1 a 1.57.

10 De forma análoga a los compuestos de acuerdo con la invención descritos en las tablas 1.1 a 1.57 resultan de forma correspondiente los compuestos de acuerdo con la invención de las tablas 3.1 a 3.57 en las que Y se refiere a azufre, R³ se refiere a metilo y los otros sustituyentes tienen en cada caso los significados indicados en las tablas 1.1 a 1.57.

15 De forma análoga a los compuestos de acuerdo con la invención descritos en las tablas 1.1 a 1.57 resultan de forma correspondiente los compuestos de acuerdo con la invención de las tablas 4.1 a 4.57 en las que Y se refiere a azufre, R³ se refiere a etilo y los otros sustituyentes tienen en cada caso los significados indicados en las tablas 1.1 a 1.57.

Las abreviaturas usadas significan:

Ac	acetoxi	Bu	butilo	Et	etilo	Me	metilo
Pr	propilo	Pen	pentilo	Hex	hexilo	Ph	fenilo
c	ciclo	s	secundario	i	iso	t	terciario
THF	tetrahidrofurano						

E1, E2, E3, E4 indican compuestos enantioméricamente puros. D1, D2, D3, D4 indican diastereómeros de un par de diastereómeros presentes en forma de racematos de dos enantiómeros.

20

Datos analíticos tabla 1.2

n.º	RMN
1.2-7	[CDCl ₃] 0,89-0,97 (m, 3H); 1,17-1,21 (m, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (m, 1H); 3,84 (m, 1H); 3,96 (m, 1H); 6,58 (d, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-8	[CDCl ₃] 0,93 (m, 6H); 1,14 (m, 3H); 1,76 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (m, 1H); 3,78-3,86 (m, 1H), 3,91 (m, 1H); 6,61 (d, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-10	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 3,62-3,79 (m, 2H); 3,90 (d, 1H); 5,77-6,05 (tt, 1H); 7,06 (s, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-11	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 3,85 (d, 1H), 3,90-4,00 (m, 1H); 4,10-4,20 (m, 1H); 7,05 (s, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-15	[CDCl ₃] 2,67-2,73 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,59-3,68 (m, 2H); 3,91 (d, 1H); 7,18 (m, 2H); 7,42 (m, 3H).
1.2-16	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 3,92-4,03 (m, 2H); 5,18-5,27 (m, 2H); 5,82-5,91 (m, 1H); 6,88 (s, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-20	[CDCl ₃] 1,43 (m, 3H); 2,57-2,67 (m, 1H); 2,75-2,90 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,40 (m, 1H); 3,88 (m, 1H); 4,29 (m, 1H); 6,86 (t, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.2-21	[CDCl ₃] 1,13 (m, 6H); 1,22 (m, 1H); 3,34-3,44 (m, 7H); 3,77-3,87 (m, 1H); 4,05 (m, 1H); 7,02 (t, 1H); 7,13 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-24	[CDCl ₃] 3,00 (s, 3H); 3,26-3,38 (m, 6H); 3,81-3,95 (m, 3H); 7,16 (m, 1H); 7,41 (m, 4H).
1.2-25	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,58 (c, 2H); 2,72 (t, 2H); 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,55 (m, 2H); 3,88 (d, 1H); 7,13 (m, 2H); 7,41 (m, 3H).
1.2-40	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 3,94 (d, 1H); 4,18-4,24 (m, 1H); 4,32-4,38 (m, 1H); 7,19 (m, 2H); 7,41 (m, 3H).
1.2-41 D1	[CDCl ₃] D1: 1,65 (d, 3H); 3,37 (s, 3H); 3,45 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 4,95 (m, 1H); 7,09 (d, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-41 D2	[CDCl ₃] D2: 1,63 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,97 (d, 1H); 4,93 (m, 1H); 7,08 (d, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,43 (m, 3H).
1.2-42	[CDCl ₃] 1,78 (s, 6H); 3,38 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,99 (d, 1H); 6,73 (s, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-45	[CDCl ₃] 1,09-1,17 (m, 3H); 1,73 (s, 3H); 1,96-2,12 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,40 (m, 1H); 3,94-4,00 (m, 1H); 6,80 (d, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,43 (m, 3H).
1.2-46	[CDCl ₃] 1,03 (m, 3H); 1,53-1,59 (m, 2H); 1,75 (s, 3H); 1,88-2,07 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,40 (m, 1H); 3,98 (m, 1H); 6,81 (d, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-47	[CDCl ₃] 0,71-0,78 (m, 4H); 1,31 (m, 1H); 1,83 (d, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (m, 1H); 3,90-4,01 (m, 1H); 7,01 (d, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-48 D1	[CDCl ₃] D1: 1,40 (d, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (d, 1H); 3,83 (d, 1H); 4,73 (m, 1H); 6,83 (d, 1H); 7,18 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-48 D2	[CDCl ₃] D2: 1,39 (d, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,87 (d, 1H); 4,73 (m, 1H); 6,89 (d, 1H); 7,18 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-49 D1	[CDCl ₃] D1: 1,04 (t, 3H); 1,58-1,65 (m, 1H); 1,90-1,98 (m, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,49 (d, 1H); 3,80 (d, 1H); 4,55 (m, 1H); 6,73 (d, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-49 D2	[CDCl ₃] D2: 1,02 (t, 3H); 1,56-1,65 (m, 1H); 1,90-1,98 (m, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,55 (m, 1H); 6,78 (d, 1H); 7,18 (m, 1H); 7,43 (m, 3H).
1.2-50	[CDCl ₃] 1,00-1,07 (m, 6H); 2,22 (m, 1H); 3,39 (d, 3H); 3,45 (m, 1H); 3,75-3,92 (dd, 1H); 4,53 (m, 1H); 6,88 (m, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-51	[CDCl ₃] 1,61-1,66 (m, 1H); 1,91 (m, 2H); 2,09 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,85-3,99 (m, 3H); 4,30 (t, 1H); 4,65 (quint, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-53	[CDCl ₃] 1,49 (t, 3H); 2,30 (dd, 1H); 3,38 (d, 3H); 3,43 (m, 1H); 3,85 (m, 1H); 4,84 (m, 1H); 6,96 (s, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-55	[CDCl ₃] 1,43 (m, 3H); 1,81 (m, 3H); 3,38 (d, 3H); 3,41 (m, 1H); 3,83 (m, 1H); 4,78 (m, 1H); 6,91 (s, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,40 (m, 3H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.2-58	[CDCl ₃] 1,19 (m, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41-3,47 (m, 7H); 3,88 (m, 1H), 4,21 (m, 2H), 6,89 (s, 1H), 7,15 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-59	[CDCl ₃] 1,12 (c, 3H); 1,42 (m, 3H); 2,49-2,68 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,42 (m, 1H); 3,84 (m, 1H); 4,63 (m, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,39-7,47 (m, 4H).
1.2-60	[CDCl ₃] 0,57-0,61 (m, 2H); 0,82-0,87 (m, 2H); 2,82 (m, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 6,82 (s, 1H); 7,14 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-62	[CDCl ₃] 0,22-0,30 (m, 1H); 0,32-0,40 (m, 1H); 0,44-0,56 (m, 2H); 0,87 (m, 1H); 1,27 (m, 3H); 3,38-3,48 (m, 5H); 3,78-3,84 (m, 1H); 6,79 (s, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-64	[CDCl ₃] 1,33 (m, 2H); 1,62 (m, 2H); 3,35 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,99 (d, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,23 (s, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-69	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,40 (m, 4H); 3,87 (d, 1H); 5,22-5,33 (m, 1H); 7,12-7,20 (m, 1H); 7,22 (s a, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-70	[CDCl ₃] 3,24-3,34 (m, 2H); 3,40 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,49-3,59 (m, 1H); 3,67-3,74 (m, 1H); 3,91 (dd, 1H); 4,09-4,19 (m, 2H); 4,42-4,54 (m, 1H); 5,15-5,25 (m, 1H); 7,13-7,20 (m, 1H); 7,32 (s a, 1H); 7,40 (m, 1H).
1.2-71	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,02-4,13 (m, 2H); 4,53-4,13 (m, 2H); 4,70-4,80 (m, 1H); 7,13-7,20 (m, 1H); 7,38 (d a, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-73	[CDCl ₃] 1,83 -1,92 (m, 1H); 2,26-2,38 (m, 1H); 3,36 (s(3H)); 3,38 (dd, 1H); 3,70-3,76 (m, 1H); 3,78-3,91 (m, 3H); 3,94-4,02 (m, 1H); 4,51-4,61 (m, 1H); 6,95 (s a, 1H); 7,18 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-76	[CDCl ₃] 0,89-0,96 (m, 3H); 1,19 (m, 3H); 1,32-1,40 (m, 2H); 1,42-1,50 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (m, 1H), 3,79-3,86 (m, 1H); 4,04 (m, 1H); 6,54 (d, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,59 (t, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,62 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 4,17 (c, 2H); 7,15 (m, 1H); 7,28 (s, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-96	[CDCl ₃] 1,24-1,32 (m, 6H); 2,57 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,84 (d, 1H); 4,12-4,20 (m, 2H); 4,37-4,44 (m, 1H); 7,14 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-102	[CDCl ₃] 1,88-1,95 (quint, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,37-3,43 (m, 6H); 3,69 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 6,94 (s, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-119	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,96 (d, 1H); 4,62 (m, 2H); 7,17 (m, 1H); 7,28 (s, 1H); 7,41 (m, 3H); 7,68 (d, 1H); 7,86 (d, 1H); 8,69 (s, 1H).
1.2-138	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H), 3,44 (d, 1H), 3,99 (d, 1H); 4,47-4,58 (m, 2H); 7,19 (m, 3H); 7,43 (m, 4H); 8,34 (d, 1H).
1.2-142	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H), 3,93 (s, 3H); 3,93 (d, 1H); 4,42-4,56 (m, 2H); 6,65 (s, 1H); 6,30 (d, 1H); 7,13-7,20 (m, 2H); 7,43 (m, 3H); 8,13 (d, 1H).
1.2-147	[CDCl ₃] 2,58 (s, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,95 (d, 1H), 4,51 (m, 2H); 7,05 (s, 1H); 7,10 (s, 1H); 7,18 (m, 2H); 7,41 (m, 3H); 7,48 (d, 1H).
1.2-148	[CDCl ₃] 1,30 (t, 3H); 2,83 (c, 2H); 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,95 (d, 1H); 4,51 (m, 2H); 7,05 (d, 1H); 7,09 (s, 1H); 7,17 (m, 2H); 7,42 (m, 3H); 8,50 (d, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.2-149	[CDCl ₃] 1,01 (m, 4H); 2,03 (m, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,97 (d, 1H); 4,50 (m, 2H); 6,95 (d, 1H); 7,06 (s, 1H); 7,17 (m, 2H); 7,41 (m, 3H); 8,40 (d, 1H).
1.2-150	[CDCl ₃] 0,97 (t, 3H); 1,70-1,80 (m, 2H); 2,78 (t, 2H); 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,94 (d, 1H); 4,51 (m, 2H); 7,05 (d, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,18 (m, 2H); 7,41 (m, 3H); 8,50 (d, 1H).
1.2-200	[CDCl ₃] 2,46 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,22-4,38 (m, 2H); 7,01 (s a, 1H); 7,11-7,20 (m, 1H); 7,42 (m, 3H); 8,20 (s, 1H).
1.2-201	[CDCl ₃] 2,27 (s, 3H); 2,42 (s, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,93 (d, 1H); 4,27 (m, 2H); 6,81 (s, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-202	[CDCl ₃] 1,30 (t, 3H); 2,42 (s, 3H); 2,66 (c, 2H); 3,34 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,28 (m, 2H); 6,80 (s, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-203	[CDCl ₃] 1,30 (m, 6H); 2,66 (c, 2H); 2,79 (c, 2H); 3,34 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,28 (m, 2H); 6,79 (s, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,42 (m, 3H).
1.2-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 4,14 (c, 2H); 4,38 (m, 2H); 6,96 (s, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,40 (m, 4H); 7,46 (s, 1H).
1.2-207	[CDCl ₃] 3,35 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,90 (d, 1H); 4,37-4,43 (m, 2H); 4,68 (c, 2H); 7,02 (s, 1H); 7,18 (m, 1H); 7,41 (m, 3H); 7,53 (s, 1H); 7,56 (s, 1H).
1.2-210	[CDCl ₃] 1,02 (m, 2H); 1,11 (m, 2H); 3,35 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,57 (m, 1H); 3,89 (d, 1H); 4,36 (m, 2H); 6,95 (s, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,39-7,56 (m, 5H).
1.2-211	[CDCl ₃] 2,24 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,81 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,26-4,38 (m, 2H); 6,83 (s a, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,28 (s, 1H); 7,40 (m, 3H).
1.2-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,26 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 4,09 (c, 2H); 4,27-4,39 (m, 2H); 6,83 (s a, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,32 (s, 1H); 7,41 (m, 3H).
1.2-241	[CDCl ₃] 3,40 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,97 (d, 1H); 4,56-4,68 (m, 2H); 6,95 (s, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,28 (s a, 1H); 7,92 (m, 3H); 8,19 (s, 1H).
1.2-257	[CDCl ₃] 1,42 (t, 3H); 3,36 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,81 (d, 1H); 3,91 (s, 3H); 3,96 (c, 2H); 4,20-4,32 (m, 2H); 7,03 (s a, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,20 (s, 1H); 7,40 (m, 3H).
1.2-258	[CDCl ₃] 3,35 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,71 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 3,90 (s, 3H); 4,25 (d, 1H); 7,03 (s a, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,17 (s, 1H); 7,40 (m, 3H).

Datos analíticos tabla 1.3

n.º	RMN
1.3-1	[CDCl ₃] 3,41 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 5,85 (s, 1H); 6,72 (s, 1H); 7,38 (t, 1H); 7,41 (d, 1H); 7,53 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
1.3-9	[CDCl ₃] 3,39-3,46 (m, 4H); 3,85-3,94 (m, 2H); 4,06-4,14 (m, 1H); 7,07 (s, 1H); 7,38 (m, 1H); 7,43 (m, 1H); 7,56 (m, 1H); 7,69 (m, 1H).
1.3-16	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 3,90-4,03 (m, 2H); 5,18-5,27 (m, 2H); 5,80-5,91 (m, 1H); 6,86 (s, 1H); 7,37 (m, 1H); 7,42 (m, 1H); 7,52 (m, 1H); 7,69 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.3-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,85 (m, 2H); 2,82 (m, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 6,81 (s, 1H); 7,37 (t, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,53 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
1.3-94	[CDCl ₃] 1,28 (m, 3H); 2,60 (t, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,62 (m, 2H); 3,86 (d, 1H); 4,18 (c, 2H); 7,31 (s, 1H); 7,38 (t, 1H); 7,41 (d, 1H); 7,53 (d, 1H); 7,68 (s, 1H).
1.3-96	[CDCl ₃] 1,22-1,30 (m, 6H); 2,52-2,60 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,11-4,20 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 7,25 (s, 1H); 7,36 (t, 1H); 7,43 (d, 1H); 7,52 (d, 1H); 7,68 (s, 1H).
1.3-102	[CDCl ₃] 1,92 (quint, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,35-3,43 (m, 6H); 3,69 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 6,93 (s, 1H); 7,31-7,43 (m, 2H); 7,52 (d, 1H); 7,68 (s, 1H).
1.3-110	[CDCl ₃] 3,36 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,52 (m, 2H); 7,18 (s, 1H); 7,31-7,77 (m, 3H); 7,52 (m, 1H); 7,67 (m, 2H); 8,35 (s, 1H).
1.3-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,14 (c, 2H); 4,38 (m, 2H); 6,95 (s, 1H); 7,36-7,46 (m, 4H); 7,53 (m, 1H); 7,68 (s, 1H).
1.3-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,08 (m, 2H); 4,32 (m, 2H); 6,81 (s, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,38 (t, 1H); 7,41 (t, 1H); 7,53 (d, 1H); 7,68 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.5

n.º	RMN
1.5-1	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,41 (s, 3H); 3,46 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 5,73 (s a, 1H); 6,72 (s a, 1H); 7,27 (d, 1H); 7,32 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
1.5-9	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,47 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 3,82-3,97 (m, 1H); 4,02-4,17 (m, 1H); 7,10 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,52 (s, 1H).
1.5-16	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,45 (d, 1H); 3,87 (d, 1H); 3,90-4,07 (m, 2H); 5,20 (d, 1H); 5,24 (d, 1H); 5,81-5,92 (m, 1H); 6,89 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,51 (1H).
1.5-60	[CDCl ₃] 0,54-0,64 (m, 2H); 0,79 -0,87 (m, 2H); 2,38 (s, 3H); 2,77-2,86 (m, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 6,83 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,43 (d, 1H); 7,50 (s, 1H).
1.5-94	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 2,38 (s, 3H); 2,59 (t, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,57-3,66 (m, 2H); 3,85 (d, 1H); 4,17 (c, 2H); 7,21-7,33 (3H); 7,44 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
1.5-96	[CDCl ₃] D1: 1,26 (t, 3H); 1,30 (d, 3H); 2,38 (s, 3H); 2,55 (d, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,83 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,33-4,46 (m, 1H); 7,22 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,51 (s, 1H), D 2: 1,27 (t, 3H); 1,30 (d, 3H); 2,38 (s, 3H); 2,57 (d, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,84 (d, 1H); 4,16 (c, 2H); 4,33-4,46 (m, 1H); 7,22 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
1.5-102	[CDCl ₃] 1,91 (pent, 2H); 2,38 (c, 2H); 2,39 (s, 3H); 3,37 (s, 3H); 3,30-3,43 (m, 2H); 3,42 (d, 1H); 3,67 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 6,94 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
1.5-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 2,38 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,14 (c, 2H); 4,31-4,42 (m, 2H); 6,97 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,40 s, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,50 (s, 1H).

(continuación)

n.º	RMN
1.5-212	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 2,24 (s, 3H); 2,38 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,06 (c, 2H); 4,25-4,38 (m, 2H); 6,83 (s a, 1H); 7,25 (d, 1H); 7,31 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,50 (s, 1H).

Datos analíticos tabla I.6

n.º	RMN
1.6-1	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 4,41 (s, 3H); 3,47 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 5,66 (s a, 1H); 6,72 (s a, 1H); 7,29 (d, 1H); 7,34 (t, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,54 (s, 1H).
1.6-9	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 3,39 (s, 3H); 3,47 (d, 1H); 3,82-3,97 (m, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,02-4,16 (m, 1H); 7,09 (s a, 1H); 7,28 (d, 1H); 7,34 (t, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,53 (s, 1H).
1.6-16	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,45 (d, 1H); 3,87 (d, 1H); 3,90-4,04 (m, 2H); 5,18 (d, 1H); 5,24 (d, 1H); 5,81-5,92 (m, 1H); 6,88 (s a, 1H); 7,29 (d, 1H); 7,33 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,54 (s, 1H).
1.6-60	[CDCl ₃] 0,59 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 2,81-2,84 (m, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,87 (d, 1H); 6,85 (s a, 1H); 2,27 (d, 1H); 7,33 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,53 (s, 1H).
1.6-94	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 1,28 (t, 3H); 2,59 (m, 2H); 2,67 (c, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,58-3,66 (m, 2H); 3,86 (d, 1H); 4,17 (c, 2H); 7,27 (d, 1H); 7,30 (s a, 1H); 7,34 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,54 (s, 1H).
1.6-96	[CDCl ₃] 1,23-1,33 (m, 6H); 2,51-2,63 (m, 2H); 2,68 (c, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,85 (d, 1H); 4,12-4,20 (m, 2H); 4,36-4,44 (m, 1H); 7,25 (t a, 1H); 7,27 (d, 1H); 7,34 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,54 (s, 1H).
1.6-110	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 3,91 (d, 1H); 4,46-4,58 (m, 2H); 7,19 (t a, 1H); 7,27-7,37 (m, 3H); 7,45 (d, 1H); 7,53 (s, 1H); 7,64 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.6-206	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 1,48 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 4,14 (c, 2H); 4,31-4,43 (m, 2H); 6,96 (s a, 1H); 7,29 (d, 1H); 7,33 (t, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,54 (s, 1H).
1.6-212	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 1,45 (t, 3H); 2,26 (s, 3H); 2,67 (c, 2H); 3,35 (s, 3H); 3,44 (d, 1H); 3,87 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,28-4,37 (m, 2H); 6,85 (s a, 1H); 7,27 (d, 1H); 7,33 (s, 1H); 7,34 (t, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,53 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.7

n.º	RMN
1.7-1	[CDCl ₃] 3,41 (s, 3H); 3,46 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 5,79 (s a, 1H); 6,72 (s a, 1H); 7,00 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,26 (s, 1H); 7,34 (t, 1H).
1.7-9	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,45 (d, 1H); 3,86 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 3,86-3,95 (m, 1H); 4,01-4,18 (m, 1H); 7,01 (d, 1H); 7,09 (s a, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,26 (s, 1H); 7,34 (t, 1H).
1.7-16	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 3,80-4,06 (m, 2H); 5,19 (d, 1H); 5,25 (d, 1H); 5,81-5,90 (m, 1H); 6,88 (s a, 1H); 7,00 (d, 1H); 7,17 (d, 1H); 7,26 (s, 1H); 7,33 (t, 1H).

(continuación)

n.º	RMN
1.7-60	[CDCl ₃] 0,59 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 2,82 (m, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 6,85 (s a, 1H); 7,00 (d, 1H); 7,17 (d, 1H); 7,26 (s, 1H); 7,33 (t, 1H).
1.7-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,60 (t, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,57-3,68 (m, 2H); 3,84 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,16 (c, 2H); 6,69 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,30 (s a, 1H); 7,31 (t, 1H).
1.7-96	[CDCl ₃] D1: 1,24 (t, 3H); 1,29 (d, 3H); 2,55 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,85 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,10-4,20 (m, 2H); 4,35-4,43 (m, 1H); 6,99 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,25 (s, 1H); 7,26 (s a, 1H); 7,33 (t, 1H), D2: 1,26 (t, 3H); 1,30 (d, 3H); 2,58 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,85 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,10-4,20 (m, 2H); 4,35-4,43 (m, 1H); 6,99 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,25 (s, 1H); 7,26 (s a, 1H); 7,33 (t, 1H).
1.7-110	[CDCl ₃] 3,36 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,47-4,56 (m, 2H); 7,00 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,23 (t a, 1H); 7,25 (s, 1H); 7,33 (t, 1H); 7,34 (d, 1H); 7,66 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.7-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 3,36 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,33-4,42 (m, 2H); 6,97 (s a, 1H); 7,00 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,26 (s, 1H); 7,33 (t, 1H); 7,41 (s, 1H); 7,46 (s, 1H).
1.7-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,26 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,29-4,37 (m, 2H); 6,85 (s a, 1H); 7,01 (d, 1H); 7,17 (d, 1H); 7,26 (s, 1H); 7,33 (s, 1H); 7,36 (t, 1H).

Datos analíticos tabla 1.11

n.º	RMN
1.11-4	[CDCl ₃] 0,96 (t, 3H); 1,54-1,66 (m, 2H); 3,22-3,38 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 6,78 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-7	[CDCl ₃] D1: 0,93 (t, 3H); 1,19 (d, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 3,96 (m, 1H); 6,55 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,19 (d, 2H), D2: 0,95 (t, 3H); 1,20 (d, 3H); 1,52 (m, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,96 (m, 1H); 6,55 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,19 (d, 2H).
1.11-8	[CDCl ₃] D1: 0,92 (d, 6H); 1,14 (d, 3H); 1,75 (sept, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,86-3,94 (m, 1H); 6,60 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H), D2: 0,96 (d, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,75 (sept, 1H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,86-3,94 (m, 1H); 6,60 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-9	[CDCl ₃] 3,39 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 3,84-3,96 (m, 1H); 4,04-4,16 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,1 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-10	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,61-3,87 (m, 2H); 3,86 (d, 1H); 5,91 (tt, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,04 (t a, 1H); 7,21 (d, 1H).
1.11-11	[CDCl ₃] 3,38 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 3,88-4,03 (m, 1H); 4,06-4,22 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,03 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-15	[CDCl ₃] 2,62-2,80 (m, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,55-3,72 (m, 2H); 3,88 (d, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,18 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-16	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 3,90-4,06 (m, 2H); 5,20 (d, 1H); 5,25 (d, 1H); 5,81-5,92 (m, 1H); 6,86 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.11-19 D1	[CDCl ₃] D1: 1,25 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,35-3,44 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,37 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 4,20 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,94 (d a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-19 D2	[CDCl ₃] D2: 1,24 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (m, 2H); 3,82 (d, 1H); 4,21 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,91 (d a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-20	[CDCl ₃] D1: 1,43 (d, 3H); 2,55-2,66 (m, 1H); 2,73-2,90 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,23-4,32 (m, 1H); 6,84 (t a, 1H); 6,90 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H), D2: 1,44 (d, 3H); 2,55-2,66 (m, 1H); 2,73-2,90 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,23-4,32 (m, 1H); 6,84 (t a, 1H); 6,90 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-21	[CDCl ₃] 1,10-1,19 (m, 7H); 1,20-1,28 (m, 1H); 3,30-3,45 (m, 8H); 3,74-3,86 (m, 1H); 4,00-4,13 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,04 (t a, 1H); 7,19 (d, 2H).
1.11-24	[CDCl ₃] 3,00 (s, 3H); 3,23-3,39 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,80-3,94 (m, 2H); 3,90 (d, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,41 (t a, 1H).
1.11-25	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,58 (cuart, 2H); 2,73 (t, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,48-3,63 (m, 2H); 3,85 (d, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,13 (s a, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-40	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,19-4,39 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,18 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-41 D2	[CDCl ₃] D2: 1,65 (d, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,90-5,00 (m, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,07 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-41 D1	[CDCl ₃] D1: 1,64 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,88-4,98 (m, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,04 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-42	[CDCl ₃] 1,78 (s, 6H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 6,82 (s, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-45	[CDCl ₃] D1: 1,11 (t, 3H); 1,73 (s, 3H); 1,90-2,19 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 6,28 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H), D2: 1,15 (t, 3H); 1,74 (s, 3H); 1,90-2,19 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 6,28 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-46 D1	[CDCl ₃] D1: 1,04 (t, 3H); 1,50-1,63 (m, 2H); 1,75 (s, 3H); 1,82-2,06 (m, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 6,82 (s a, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-46 D2	[CDCl ₃] D2: 1,01 (t, 3H); 1,48-1,60 (m, 2H); 1,74 (s, 3H); 1,85-1,88 (m, 1H); 2,01-2,11 (m, 1H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 6,79 (s a, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-47	[CDCl ₃] D1: 0,75 (m, 4H); 1,31 (m, 1H); 1,83 (s, 3H); 3,32 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,91 (d, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,01 (s a, 1H); 7,20 (d, 1H), D2: 0,75 (m, 4H); 1,31 (m, 1H); 1,82 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,99 (d, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,01 (s a, 1H); 7,20 (d, 1H).
1.11-48 D1	[CDCl ₃] D1: 1,41 (d, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 4,65-4,79 (m, 1H); 6,83 (d a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-48 D2	[CDCl ₃] D2: 1,40 (d, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,66-4,78 (m, 1H); 6,87 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-49 D1	[CDCl ₃] D1 1,04 (t, 3H); 1,54-1,68 (m, 1H); 1,90- 2,01 (m, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,77 (d, 1H); 4,46-4,60 (m, 1H); 6,7 (d a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).

(continuación)

n.º	RMN
1.11-49 D2	[CDCl ₃] D2: 1,02 (t, 3H); 1,55-1,68 (m, 1H); 1,89- 2,00 (m, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 4,47-4,60 (m, 1H); 6,75 (d a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-50	[CDCl ₃] D1: 1,02 (m, 6H); 2,16-2,28 (m, 1H); 3,38 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,78 (d, 1H); 4,46-4,59 (m, 1H); 6,83 (d a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,21 (d, 2H), D2: 1,05 (m, 6H); 2,16-2,28 (m, 1H); 3,43 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,46-4,59 (m, 2H); 6,88 (d a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-51	[CDCl ₃] 1,58-1,69 (m, 1H); 1,34-1,98 (m, 2H); 2,05-2,15 (m, 1H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,81-3,96 (m, 2H); 3,95 (d, 1H); 4,25-4,33 (m, 1H); 4,57-4,68 (m, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,21 (s a, 1H).
1.11-53	[CDCl ₃] D1: 1,47 (d, 3H); 2,31 (d, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 4,78-4,88 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,95 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H), D2: 1,50 (d, 3H); 2,32 (d, 1H); 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,78-4,88 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,95 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-55	[CDCl ₃] D1: 1,41 (d, 3H); 1,82 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 4,72-4,82 (m, 1H); 6,86-6,94 (m, 2H); 7,20 (d, 2H), D2: 1,44 (d, 3H); 1,82 (d, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,72-4,82 (m, 1H); 6,86-6,94 (m, 2H); 7,20 (d, 2H).
1.11-58	[CDCl ₃] D1: 1,19 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,43 (s, 3H); 3,46 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 4,16-4,28 (m, 2H); 6,85 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H), D2: 1,21 (d, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,44 (s, 3H); 3,46 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 4,16-4,28 (m, 2H); 6,85 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-59	[CDCl ₃] D1: 1,12 (t, 3H); 1,42 (d, 3H); 2,44-2,69 (m, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 4,59-4,68 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,45 (d a, 1H), D2: 1,13 (t, 3H); 1,41 (d, 3H); 2,44-2,69 (m, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,59-4,68 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,45 (d a, 1H).
1.11-60	[CDCl ₃] 0,56-0,63 (m, 2H); 0,82-0,88 (m, 2H); 2,78-2,86 (m, 1H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,80 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-62	[CDCl ₃] D1: 0,22-0,32 (m, 2H); 0,43-0,54 (m, 2H); 0,83-0,93 (m, 1H); 1,27 (d, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,38-3,48 (m, 1H); 3,81 (d, 1H); 6,26 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,21 (d, 2H), D2: 0,32-0,43 (m, 2H); 0,54-0,63 (m, 2H); 0,83-0,93 (m, 1H); 1,28 (d, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,38-3,48 (m, 1H); 3,82 (d, 1H); 6,26 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-64	[CDCl ₃] 1,29-1,40 (m, 2H); 1,57-1,68 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 6,92 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,24 (s a, 1H).
1.11-70	[CDCl ₃] 3,19-3,28 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,90 (d, 1H); 4,10-4,19 (m, 2H); 4,40-4,54 (m, 1H) 6,91 (t, 1H); 7,23 (d a, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-71	[CDCl ₃] 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,02-4,11 (m, 2H); 4,54-4,62 (m, 2H); 4,71-4,80 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,37 (d a, 1H).
1.11-73	[CDCl ₃] 1,83 -1,92 (m, 1H); 2,26-2,38 (m, 1H); 3,33 (dd, 1H); 3,36 (s(3H)); 3,70-3,76 (m, 1H); 3,78-3,91 (m, 3H); 3,94-4,02 (m, 1H); 4,51-4,61 (m, 1H); 6,91 (t, 1H); 6,94 (s a, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-74	[CDCl ₃] 1,60-1,70 (m, 1H); 2,02-2,13 (m, 1H); 2,48-2,60 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,32-3,44 (m, 1H); 3,54-3,58 (m, 1H); 3,71-3,95 (m, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,91 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.11-76	[CDCl ₃] D1: 0,92 (t, 3H); 1,18 (d, 3H); 1,29-1,43 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 3,97-4,10 (m, 1H); 6,53 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,21 (d, 2H), D2: 0,94 (t, 3H); 1,20 (d, 3H); 1,43-1,53 (m, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,97-4,10 (m, 1H); 6,53 (d a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,21 (d, 2H).
1.11-93	[CDCl ₃] 2,61 (t, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,62 (c, 2H); 3,72 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 2,29 (s a, 1H).
1.11-96	[CDCl ₃] D1: 1,25 (t, 3H); 1,30 (d, 3H); 2,50-2,62 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 4,17 (c, 2H); 4,40 (m, 1H); 6,91 t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,25 (s a, 1H), D2: 1,26 (t, 3H); 1,31 (d, 3H); 2,50-2,62 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,18 (c, 2H); 4,40 (m, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,25 (s a, 1H)
1.11-102	[CDCl ₃] 1,92 (pent, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,38-3,42 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,94 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-110	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,49-4,56 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,19 (d, 2H); 7,33 (d, 1H); 7,65 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.11-111	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,45-4,58 (m, 2H); 6,88-6,96 (m, 2H); 7,18 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,79 (m, 1H); 8,18 (s, 1H).
1.11-113	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H), 3,35 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 3,93 (s, 3H); 4,40-4,52 (m, 2H); 6,73 (d, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,04 (t a, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,56 (dd, 1H); 8,11 (d, 1H).
1.11-119	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 4,58 - 4,67 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,22 (s a, 1H); 7,68 (d, 1H); 7,84 (d, 1H); 8,69 (s, 1H).
1.11-135	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,49-4,61 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,28 (s, 2H); 8,59 (s, 2H).
1.11-136	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,51 - 4,62 (m, 2H); 6,87 (s, 1H); 6,93 (t, 1H); 7,12 (d, 1H); 7,22 (d, 2H); 7,25 (s a, 1H); 8,20 (d, 1H).
1.11-137	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,51 - 4,62 (m, 2H); 6,87 (s, 1H); 6,93 (t, 1H); 7,12 (d, 1H); 7,22 (d, 2H); 7,25 (s a, 1H); 8,20 (d, 1H).
1.11-138	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,44-4,59 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,20 (s a, 1H), 7,20 (d, 2H); 7,42 (s, 1H); 8,34 (d, 1H).
1.11-142	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 3,93 (s, 3H); 4,42-4,56 (m, 2H); 6,65 (s, 1H); 6,79 (d, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,12 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H); 8,13 (d, 1H).
1.11-147	[CDCl ₃] 2,56 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,43-4,58 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,02 (d, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,16 (t a, 1H); 7,21 (d, 2H); 8,47 (d, 1H).
1.11-148	[CDCl ₃] 1,31 (t, 3H); 2,83 (c, 2H); 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,45-4,58 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,03 (d, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,16 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H); 8,50 (d, 1H).
1.11-149	[CDCl ₃] 1,21 (m, 2H); 1,42 (m, 2H); 2,57 (m, 1H); 3,35 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 4,01 (d, 1H); 4,55-4,73 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,15 (s, 1H); 7,22 (d, 2H); 7,41 (d, 1H); 7,63 (t a, 1H); 8,57 (d, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.11-150	[CDCl ₃] 0,97 (t, 3H); 1,70-1,82 (m, 2H); 2,77 (t, 2H); 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,44-4,58 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,04 (d, 1H); 7,07 (s, 1H); 7,16 (t a, 1H); 7,21 (d, 2H); 8,50 (d, 1H).
1.11-152	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,55-4,69 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,30 (t a, 1H); 7,44 (d, 1H); 7,60 (s, 1H); 8,71 (d, 1H).
1.11-179	[CDCl ₃] 3,41 (d, 1H); 3,44 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 4,74-4,86 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,22 (d, 2H); 7,97 (s, 1H); 8,20 (s a, 1H); 8,76 (s, 1H).
1.11-180	[CDCl ₃] 3,26 (t, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,33 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,84-3,92 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,52 (s a, 1H); 7,91 (s, 1H); 8,72 (s, 1H).
1.11-189	[CDCl ₃] 2,48 (s, 6H); 3,42 (d, 1H); 3,46 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,62-4,73 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,21 (d, 2H); 8,04 (s a, 1H).
1.11-191	[CDCl ₃] 3,40 (d, 1H); 3,43 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 3,95 (s, 6H); 4,51-4,15 (m-2H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,95 (s a, 1H).
1.11-194	[CDCl ₃] 3,39 (d, 1H); 3,42 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,65 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,32 (d, 1H); 7,84 (a, 1H); 8,71 (d, 1H); 9,20 (s, 1H).
1.11-197	[CDCl ₃] 2,29 (s, 3H); 2,38 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 4,28 (d, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,19 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-199	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,34-4,47 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,09 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H); 8,31 (s, 1H); 8,45 (s, 1H).
1.11-200	[CDCl ₃] 2,46 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,24 - 4,37 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 6,93 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-201	[CDCl ₃] 2,26 (s, 3H); 2,42 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,26 (m, 2H); 6,8 (s a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,19 (d, 1H).
1.11-202	[CDCl ₃] 1,30 (t, 3H); 2,42 (s, 3H); 2,65 (c, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,90 (d, 1H); 4,21-4,33 (m, 2H); 6,77 (t a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
1.11-203	[CDCl ₃] 1,29 (t, 3H); 1,30 (t, 3H); 2,66 (c, 2H); 2,79 (c, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 4,22-4,33 (m, 2H); 6,26 (s, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,19 (d, 2H).
1.11-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,33-4,43 (m, 2H); 6,88 (t, 1H); 6,94 (s a, 1H); 7,18 (d, 2H); 7,41 (s, 1H); 7,46 (s, 1H).
1.11-207	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,33-4,46 (m, 2H); 4,69 (c, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,02 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,53 (s, 1H); 7,56 (s, 1H).
1.11-208	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,32-4,48 (m, 2H); 6,07 (tt, 1H); 6,90 (t, 1H); 6,98 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,48 (s, 1H); 7,54 (s, 1H).
1.11-210	[CDCl ₃] 0,98-1,08 (m, 2H); 1,10-1,17 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,52-3,59 (m, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,30-4,41 (m, 1H); 6,91 (t, 1H); 6,93 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,43 (s, 1H); 7,46 (s, 1H).
1.11-211	[CDCl ₃] 2,24 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,81 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,26-4,38 (m, 2H); 6,82 (s a, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,28 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.11-212	[CDCl ₃] 1,45 (t, 3H); 2,24 (s, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,27-4,39 (m, 2H); 6,80 (s a, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,33 (s, 1H).
1.11-213	[CDCl ₃] 1,47 (t, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,33 (d, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,03 (s a, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,72 (s, 1H).
1.11-238	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 4,60 (d, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,26 (d, 1H); 7,33 (t a, 1H); 7,76 (d, 1H); 8,35 (d, 1H).
1.11-239	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,62 (d, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,28 (s, 1H); 7,30 (d, 1H); 8,48 (d, 1H); 8,58 (s, 1H).
1.11-240	[CDCl ₃] 2,22 (s, 3H); 2,36 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,44 (s, 3H); 6,93 (t, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,76 (s a, 1H).
1.11-241	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,56-4,69 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 6,93 (m, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,28 (s a, 1H); 8,19 (s, 1H).
1.11-242	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,52-4,66 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,23 (s a, 1H); 7,32 (s, 1H); 8,36 (s, 1H).
1.11-243	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,51- 4,64 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,22 (d, 2H); 7,31 (s, 1H); 8,49 (s, 1H).
1.11-244	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,91 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,45-4,60 (m, 2H); 6,73 (s, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,20 (s a, 1H); 7,21 (d, 2H); 8,23 (s, 1H).
1.11-245	[CDCl ₃] 2,29 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,42-4,57 (m, 2H); 6,92 (t, 1H); 7,10 (s a, 1H); 7,18 (s, 1H); 7,21 (d, 2H); 8,18 (s, 1H).
1.11-246	[CDCl ₃] 2,55 (s, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,50 (d, 2H); 6,91 (t, 1H); 7,03 (t a, 1H); 7,16 (d, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,53 (d, 1H).
1.11-247	[CDCl ₃] 2,58 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,48-4,60 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,02 (t a, 1H); 7,15 (dd, 1H); 7,21 (d, 1H); 7,56 (d, 1H); 8,45 (d, 1H).
1.11-248	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,90 (d, 1H); 4,43-4,55 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,19 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,48 (d, 1H); 7,54 (d, 1H); 8,33 (s, 1H).
1.11-249	[CDCl ₃] 2,21 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,91 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,47 (cd, 2H); 6,62 (s, 1H); 6,91 (t, 1H); 7,03 (t a, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,94 (s, 1H).
1.11-250	[CDCl ₃] 2,28 (s, 3H); 2,53 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,43-4,54 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,02 (s a, 1H); 7,02 (s, 1H); 7,21 (d, 2H); 8,30 (s, 1H).
1.11-251	[CDCl ₃] 2,56 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 4,44-4,57 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,08 (s a, 1H); 7,15 (d, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,56 (d, 1H); 8,45 (s, 1H).
1.11-252	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,91 (s, 3H); 3,98 (s, 3H); 4,32-4,47 (m, 2H); 6,27 (d, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,17 (s a, 1H); 7,19 (d, 2H); 7,49 (d, 1H).
1.11-253	[CDCl ₃] 2,32 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,91 (d, 1H); 4,36 (d, 2H); 6,91 (t, 1H); 6,95 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H); 8,34 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.11-254	[CDCl ₃] 3,34 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,74 (t, 2H); 3,85 (d, 1H); 4,26 (t, 2H); 4,32-4,46 (m, 2H); 6,91 (t, 1H); 6,93 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,47 (s, 2H).
1.11-255	[CDCl ₃] 1,47 (t, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,11 (c, 2H); 4,32 (d, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,03 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,40 (s, 1H).
1.11-256	[CDCl ₃] 1,44 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,83 (s, 3H); 4,00 (d, 1H); 4,30 (cd, 2H); 6,90 (s, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,03 (t a, 1H); 7,19 (d, 2H); 7,32 (s, 1H).
1.11-257	[CDCl ₃] 1,42 (t, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,91 (s, 3H); 3,96 (c, 2H); 4,21-4,32 (m, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,02 (s a, 1H); 7,19 (d, 2H); 7,20 (s, 1H).
1.11-258	[CDCl ₃] 3,33 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,78 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 3,90 (s, 3H); 4,20-4,30 (m, 2H); 6,89 (t, 1H); 7,02 (s a, 1H); 7,16 (s, 1H); 7,19 (d, 2H);
1.11-259	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,58 (c, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,74 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 4,40-4,52 (m, 2H); 5,98 (s, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,18 (s a, 1H); 7,20 (d, 2H).

Datos analíticos tabla 1.14

n.º	RMN
1.14-1	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,40 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,85 (d, 1H); 5,90 (s a, 1H); 6,72 (s a, 1H); 6,98 (d, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,24 (s, 1H).
1.14-9	2,39 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 3,85-3,96 (m, 1H); 4,03-4,17 (m, 1H); 6,98 (d, 1H); 7,08 (t a, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,25 (s, 1H).
1.14-16	[CDCl ₃] 2,38 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 3,90-4,05 (m, 2H); 5,19 (d, 1H); 5,24 (d, 1H); 5,81-5,92 (m, 1H); 6,86 (s a, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,24 (s, 1H).
1.14-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 2,38 (s, 3H); 2,82 (s, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,84 (d, 1H); 6,83 (s a, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,23 (s, 1H).
1.14-94	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 2,38 (s, 3H); 2,59 (m, 2H); 3,36 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,57-3,66 (m, 2H); 3,84 (d, 1H); 4,17 (c, 2H); 6,97 (d, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,32 (s a, 1H).
1.14-96	[CDCl ₃] 1,12-1,34 (m, 6H); 2,38 (s, 3H); 2,51-2,62 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,83 (d, 1H); 4,10-4,22 (m, 2H); 4,36-4,44 (m, 1H); 6,96 (d, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,26 (s a, 1H).
1.14-102	[CDCl ₃] 1,91 (quin, 2H); 2,38 (m, 5H); 3,38 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,33-3,45 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,92 (t a, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,25 (s, 1H).
1.14-110	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 4,49-4,56 (m, 2H); 6,98 (d, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,21 (s a, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,32 (d, 1H); 7,65 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.14-136	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,39 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,97 (d, 1H); 4,48-4,59 (m, 2H); 6,98 (d, 1H); 7,16 (d, 1H); 7,21 (d, 1H); 7,25 (s, 2H); 7,26 (s a, 1H); 8,36 (d, 1H).
1.14-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 2,38 (s, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,85 (d, 1H); 4,14 (c, 2H); 4,31-4,43 (m, 2H); 6,94 (s a, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,18 (d, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,45 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.14-212	[CDCl ₃] 1,43 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 2,38 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,10 (c, 2H); 4,29-4,38 (m, 2H); 6,83 (s a, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,41 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.16

n.º	RMN
1.16-1	[CDCl ₃] 3,39 (d, 1H); 3,41 (s, 3H); 3,83 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 5,68 (s a, 1H); 6,70 (s a 1H); 6,71 (d, 1H); 6,96 (d, 1H); 7,01 (s, 1H).
1.16-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 2,81-2,84 (m, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,83 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,69 (d, 1H); 6,82 (s a, 1H); 6,94 (d, 1H); 7,00 s, 1H).
1.16-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,59 (m, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,58-3,67 (m, 2H); 3,83 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,17 (c, 2H); 6-70 (d, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,01 (s, 1H); 7,31 (t a, 1H).
1.16-96	[CDCl ₃] 1,24-1,32 (m, 6H); 2,52-2,62 (m, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 4,11-4,21 (m, 2H); 4,36-4,43 (m, 1H); 6,69 (d, 1H); 6,95 (d, 1H); 7,01 (s, 1H).
1.16-110	[CDCl ₃] 3,35 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,83 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,47-4,56 (m, 2H); 6,70 (d, 1H); 6,95 (d, 1H); 7,01 (s, 1H); 7,21 (t a, 1H); 7,32 (d, 1H); 7,65 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.16-136	[CDCl ₃] 3,39 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,84 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,48-4,59 (m, 2H); 6,71 (d, 1H); 6,97 (d, 1H); 7,02 (s, 1H); 7,16 (d, 1H); 7,27 (s a, 2H); 8,36 (d, 1H).
1.16-212	[CDCl ₃] 1,45 (t, 3H); 2,26 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 4,10 (c, 2H); 4,30-4,36 (m, 2H); 6,71 (d, 1H); 6,82 (t a, 1H); 6,94 (d, 1H); 7,00 (s, 1H); 7,32 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.18

n.º	RMN
1.18-1	[CDCl ₃] 3,42 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 5,86 (s a, 1H); 6,70 (s a, 1H); 7,43 (d, 1H); 7,61 (d, 1H); 7,70 (s, 1H).
1.18-9	[CDCl ₃] 3,40 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,83-3,98 (m, 1H); 3,82 (d, 1H); 4,03-4,19 (m, 1H); 7,08 (s a, 1H); 7,43 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
1.18-16	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,93 (d, 1H); 3,92-4,06 (m, 2H); 5,19 (d, 1H); 5,25 (d, 1H); 5,82-5,93 (m, 1H); 6,87 (s a, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,70 (s, 1H).
1.18-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,85 (m, 2H); 2,80-2,84 (m, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 6,82 (s a, 1H); 7,41 (d, 1H); 7,59 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
1.18-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,60 (m, 2H); 3,37 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,63 (c, 2H); 3,90 (d, 1H); 4,18 (c, 2H); 7,30 (t a, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
1.18-96	[CDCl ₃] 1,25-1,32 (m, 6H); 2,50-2,51 (m, 2H); 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,13-4,21 (m, 2H); 4,31-4,46 (m, 1H); 7,27 (s a, 1H); 7,41 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,70 (s, 1H).

(continuación)

n.º	RMN
1.18-102	[CDCl ₃] 1,92 (quin, 2H); 2,41 (t, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,36-3,43 (m, 3H); 3,91 (d, 1H); 6,96 (s a, 1H); 7,41 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,70 (s, 1H).
1.18-110	[CDCl ₃] 3,37 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,98 (d, 1H); 4,48-4,56 (m, 2H); 7,21 (t a, 1H); 7,33 (d, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,65 (d, 1H); 7,69 (s, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.18-136	[CDCl ₃] 3,41 (s, 3H) 3,42 (d, 1H); 4,04 (d, 1H); 4,49-4,59 (m, 2H); 7,16 (d, 1H); 7,43 (d, 1H); 7,62 (d, 1H); 7,71 (s, 1H); 8,36 (d, 1H).
1.18-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 3,36 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,31-4,43 (m, 2H); 6,95 (s a, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,41 (d, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,58 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
1.18-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,36 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,93 (d, 1H); 4,10 (c, 2H); 4,28-4,39 (m, 2H); 6,81 (s a, 1H); 7,32 (s, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,60 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.20

n.º	RMN
1.20-1	[CDCl ₃] 3,38 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 5,85 (s a, 1H); 6,70 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-4	[CDCl ₃] 0,96 (t, 3H); 1,59 (m, 2H); 3,27-3,33 (m, 3H); 3,37 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,78 (s, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-5	[CDCl ₃] 1,21 (d, 3H); 1,23 (d, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,04-4,18 (m, 1H); 6,58 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-7	[CDCl ₃] D1: 0,93 (t, 3H); 1,18 (d, 3H); 1,48 -1,58 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,90-4,02 (m, 1H); 6,55 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H), D2: 0,96 (t, 3H); 1,20 (d, 3H); 1,48 -1,58 (m, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 3,90-4,02 (m, 1H); 6,55 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-8	[CDCl ₃] D1: 0,93 (d, 6H); 1,13 (d, 3H); 1,69-1,81 (m, 1H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 3,83-3,96 (m, 1H); 6,58 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H), D2: 0,95 (d, 6H); 1,15 (d, 3H); 1,69-1,81 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 3,83-3,96 (m, 1H); 6,58 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-9	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 3,84-3,97 (m, 1H); 4,02-4,17 (m, 1H); 7,05 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-10	[CDCl ₃] 3,33 (d, 1H), 3,38 (s, 3H); 3,66-3,80 (m, 2H); 3,89 (d, 1H); 5,78-6,05 (tt, 1H); 7,02 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-11	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,84 (d, 1H); 3,91-4,01 (m, 1H); 4,08-4,20 (m, 1H); 7,03 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-15	[CDCl ₃] 2,67-2,73 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,59-3,68 (m, 2H); 3,89 (d, 1H); 7,20 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-16	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 3,90-4,06 (m, 2H); 5,20 (d, 1H); 5,25 (d, 1H); 5,80-5,93 (m, 1H); 6,85 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.20-19 D1	[CDCl ₃] D1: 1,26 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,37-3,45 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 4,13-4,26 (m, 1H); 6,93 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-19 D2	[CDCl ₃] D2: 1,23 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,37-3,45 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 4,14-4,27 (m, 1H); 6,91 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-20	[CDCl ₃] 1,43 (t, 3H); 2,57-2,66 (m, 1H); 2,75-2,89 (m, 1H); 3,31 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,84-3,91 (m, 1H); 4,29 (m, 1H); 6,83 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-21	[CDCl ₃] 1,11-1,20 (m, 6H); 3,30-3,42 (m, 8H); 3,77-3,85 (m, 1H); 4,02 (m, 1H); 7,02 (m, 1H); 7,42 (m, 1H); 7,55 (m, 2H).
1.20-24	[CDCl ₃] 3,00 (s, 3H); 3,29-3,36 (m, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,86-3,93 (m, 3H); 7,43 (m, 2H); 7,55 (s, 2H).
1.20-25	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,58 (c, 2H); 2,73 (t, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,48-3,61 (m, 2H); 3,85 (d, 1H); 7,12 (s a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-40	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,17-4,89 (m, 2H); 7,18 (t a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-41 D1	[CDCl ₃] D1: 1,65 (d, 3H); 3,37 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,90-4,99 (m, 1H); 7,05 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-41 D2	[CDCl ₃] D2: 1,64 (d, 3H); 3,36 (s, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,95 (d, 1H); 4,89-4,98 (m, 1H); 7,05 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-42	[CDCl ₃] 1,78 (s, 6H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,99 (d, 1H); 6,80 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-45	[CDCl ₃] 1,09-1,18 (m, 3H); 1,73 (d, 3H); 1,98-2,13 (m, 2H); 3,30 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,92-4,00 (m, 1H); 6,79 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-46 D1	[CDCl ₃] D1 1,04 (t, 3H); 1,59 (m, 2H); 1,75 (s, 3H); 1,89 (m, 1H); 2,00 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,98 (d, 1H); 6,80 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-46 D2	[CDCl ₃] D2 1,01 (t, 3H); 1,52 (m, 2H); 1,74 (s, 3H); 1,92 (m, 1H); 2,05 (m, 1H); 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 6,78 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-47	[CDCl ₃] 0,70-0,80 (m, 4H); 1,26-1,33 (m, 1H); 1,82 (d, 3H); 3,30-3,34 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,90-4,02 (m, 1H); 7,00 (m, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-48 D1	[CDCl ₃] D1 1,40 (d, 3H); 3,38 (s, 3H), 3,39 (d, 1H), 3,88 (d, 1H); 4,73 (m, 1H); 6,85 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-48 D2	[CDCl ₃] D2 1,40 (d, 3H); 3,38 (s, 3H), 3,39 (d, 1H), 3,80 (d, 1H); 4,72 (m, 1H); 6,80 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-49 D1	[CDCl ₃] D1 1,03 (t, 3H); 1,58-1,64 (m, 1H); 1,90-2,00 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,80 (d, 1H); 4,55 (m, 1H); 6,70 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-49 D2	[CDCl ₃] D2 1,02 (t, 3H); 1,58-1,64 (m, 1H); 1,90-2,00 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,90 (d, 1H); 4,55 (m, 1H); 6,75 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.20-50	[CDCl ₃] D1: 0,98-1,07 (m, 6H); 2,16-2,28 (m, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,78 (d, 1H); 3,46-4,58 (m, 1H); 6,84 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H), D2: 0,98-1,07 (m, 6H); 2,16-2,28 (m, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,90 (d, 1H); 3,46-4,58 (m, 1H); 6,88 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-51 D1	[CDCl ₃] D1 1,80 (m, 1H); 1,95 (m, 2H); 2,09 (m, 1H); 3,38 (s, 3H), 3,39 (d, 1H); 3,80-3,91 (m, 3H); 4,18 (c, 1H), 4,72 (m, 1H); 7,00 (m, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-51 D2	[CDCl ₃] D2 1,60 (m, 1H); 1,93 (m, 2H); 2,14 (m, 1H); 3,38 (s, 3H), 3,42 (d, 1H); 3,80 (d, 1H); 3,83-3,97 (m, 2H); 4,30 (m, 1H), 4,65 (m, 1H); 7,20 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-51 D3	[CDCl ₃] D3 1,62 (m, 1H); 1,91 (m, 2H); 2,10 (m, 1H); 3,37 (s, 3H), 3,38 (d, 1H); 3,84-3,97 (m, 3H); 4,30 (m, 1H), 4,64 (m, 1H); 7,21 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-51 D4	[CDCl ₃] D4 1,80 (m, 1H); 1,93 (m, 2H); 2,08 (m, 1H); 3,38 (s, 3H), 3,39 (d, 1H); 3,81-3,91 (m, 2H); 4,18 (c, 1H), 4,73 (m, 1H); 7,00 (m, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-53	[CDCl ₃] 1,49 (t, 3H); 2,30 (m, 1H); 3,33 (m, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,80-3,90 (m, 1H); 4,83 (m, 1H); 6,93 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-55	[CDCl ₃] D1: 1,42 (d, 3H); 1,81 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 4,71-4,81 (m, 1H); 6,88 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H), D2: 1,45 (d, 3H); 1,82 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,71-4,81 (m, 1H); 6,88 (d a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-58	[CDCl ₃] D1: 1,18 (d, 3H); 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,43 (s, 3H); 3,46 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 4,16-4,28 (m, 2H); 6,87 (t a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H), D2: 1,20 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,43 (s, 3H); 3,44 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 4,16-4,28 (m, 2H); 6,87 (t a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-59	[CDCl ₃] 1,11 (m, 3H); 1,42 (m, 3H); 2,48-2,63 (m, 2H); 3,32 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,79-3,88 (m, 1H); 4,62 (m, 1H); 7,43-7,50 (m, 2H); 7,55 (m, 2H).
1.20-60	[CDCl ₃] 0,59 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 2,82 (m, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 6,79 (s, 1H); 7,43 (m, 1H); 7,54 (m, 2H).
1.20-60 E1	[CDCl ₃] 0,56-0,62 (m, 2H); 0,82-0,89 (m, 2H); 2,77-2,86 (m-1H); 3,33 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 6,78 (s a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).
1.20-60 E2	[CDCl ₃] 0,56-0,62 (m, 2H); 0,82-0,89 (m, 2H); 2,77-2,86 (m-1H); 3,33 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 6,78 (s a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).
1.20-62	[CDCl ₃] D1: 0,27-0,32 (m, 2H); 0,43-0,53 (m, 2H); 0,82-0,93 (m, 1H); 1,26 (d, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,37-3,46 (m, 1H); 3,82 (d, 1H); 6,76 (s a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,56 (s, 2H), D2: 0,33-0,43 (m, 2H); 0,53-0,62 (m, 2H); 0,82-0,93 (m, 1H); 1,28 (d, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,41 (s, 3H); 3,37-3,46 (m, 1H); 3,83 (d, 1H); 6,76 (s a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
1.20-64	[CDCl ₃] 1,26-1,38 (m, 2H); 1,58-1,68 (m, 2H); 3,30 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 7,23 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-69	[CDCl ₃] 3,30 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,39 (dd, 4H); 3,87 (d, 1H); 5,22-5,33 (m, 1H); 7,18 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.20-70	[CDCl ₃] D1 3,20-3,30 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,49-3,58 (m, 1H); 3,67-3,74 (m, 1H); 3,90 (d, 1H); 4,10-4,18 (m, 2H); 4,41-4,53 (m, 1H); 7,19 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H), D2 3,20-3,30 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,49-3,58 (m, 1H); 3,67-3,74 (m, 1H); 3,91 (d, 1H); 4,10-4,18 (m, 2H); 5,14-5,23 (m, 1H); 7,12 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-71	[CDCl ₃] 3,31 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,93 (d, 1H); 4,00-4,11 (m, 2H); 4,52-4,63 (m, 2H); 4,71-4,79 (m, 1H); 7,35 (d a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-73	[CDCl ₃] 1,83 -1,92 (m, 1H); 2,26-2,38 (m, 1H); 3,32 (dd, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,70-3,76 (m, 1H); 3,78-3,91 (m, 3H); 3,93-4,03 (m, 1H); 4,51-4,61 (m, 1H); 6,93 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-74	[CDCl ₃] 1,59-1,68 (m, 1H); 2,02-2,14 (m, 1H); 2,47-2,59 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,33-3,45 (m, 2H); 3,56 (dd, 1H); 3,72-3,79 (m, 1H); 3,81-3,94 (m, 2H); 3,87 (d, 1H); 6,91 (t a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-76	[CDCl ₃] D1: 0,92 (t, 3H); 1,18 (d, 3H); 1,32-1,43 (m, 2H); 1,43-1,52 (m, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 3,97-4,09 (m, 1H); 6,53 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H), D2: 0,94 (t, 3H); 1,20 (d, 3H); 1,32-1,43 (m, 2H); 1,43-1,52 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 3,97-4,09 (m, 1H); 6,53 (d a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-93	[CDCl ₃] 2,63 (t, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,62 (c, 2H); 3,73 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 7,27 (t a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,56 (2H).
1.20-96	[CDCl ₃] 1,28 (m, 6H); 2,56 (m, 2H); 3,34 (d, 1H), 3,36 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,16 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,42 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-102	[CDCl ₃] 1,91 (quint, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,30 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,39 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 6,90 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-110	[CDCl ₃] 3,35 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,52 (m, 2H); 7,20 (s, 1H); 7,32 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,55 (s, 2H); 7,65 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.20-119	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,56-4,68 (m, 2H); 7,25 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H); 7,68 (d, 1H); 7,85 (d, 1H); 8,68 (s, 1H).
1.20-135	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,55 (d, 2H); 7,21 (d, 3H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,59 (d, 2H).
1.20-136	[CDCl ₃] 3,86 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,45-4,60 (m, 2H); 7,16 (d, 1H); 7,23 (s a, 1H); 7,24 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,36 (d, 1H).
1.20-137	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,57 (m, 2H); 6,86 (m, 1H); 7,11 (m, 1H); 7,20 (s, 1H); 7,47 (s, 1H); 7,57 (s, 2H); 8,20 (d, 1H).
1.20-138	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,45-4,58 (m, 2H); 7,18 (d, 1H); 7,23 (t a, 1H); 7,41 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,57 (s, 2H); 8,34 (d, 1H).
1.20-142	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 3,93 (s, 3H); 4,41-4,56 (m, 2H); 6,65 (s, 1H); 6,79 (d, 1H); 7,13 (t a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,13 (d, 1H).
1.20-147	[CDCl ₃] 2,56 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,44-4,56 (m, 2H); 7,02 (d, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,14 (t a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,47 (d, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.20-148	[CDCl ₃] 1,31 (t, 3H); 2,81 (c, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,45-4,58 (m, 2H); 7,03 (d, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,15 (t a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,50 (d, 1H).
1.20-149	[CDCl ₃] 0,94-1,06 (m, 4H); 1,97-2,06 (m, 1H); 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,42-4,56 (m, 2H); 6,95 (d, 1H); 7,05 (s, 1H); 7,13 (t a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,40 (d, 1H).
1.20-150	[CDCl ₃] 0,97 (t, 3H); 1,70-1,82 (m, 2H); 2,73-2,83 (m, 2H); 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,94 (d, 1H); 4,43-4,58 (m, 2H); 7,04 (d, 1H); 7,07 (s, 1H); 7,15 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,50 (d, 1H).
1.20-152	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,55-4,69 (m, 2H); 7,28 (t a, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 7,61 (s, 1H); 8,71 (d, 1H).
1.20-191	[CDCl ₃] 3,39 (d, 1H); 3,43 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 3,95 (s, 6H); 4,50-4,64 (m, 2H); 7,43 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 7,45 (s a, 1H).
1.20-199	[CDCl ₃] 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,33-4,47 (m, 2H); 7,08 (t a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,31 (s, 1H); 8,45 (s, 1H).
1.20-200	[CDCl ₃] 2,46 (s, 3H); 3,32 (d, 1H); 3,33 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 4,23-4,37 (m, 2H); 7,00 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,19 (s, 1H).
1.20-201	[CDCl ₃] 2,26 (s, 3H); 2,42 (s, 3H); 3,32 (d, 1H); 3,33 (s, 3H); 3,91 (d, 1H); 4,22-4,33 (m, 2H); 6,80 (t a, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-202	[CDCl ₃] 1,30 (t, 3H); 2,42 (s, 3H); 2,65 (c, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,90 (d, 1H); 4,21-4,34 (m, 2H); 6,75 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-203	[CDCl ₃] 1,29 (t, 3H); 1,30 (t, 3H); 2,66 (c, 2H); 2,78 (c, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,33 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,24-4,33 (m, 2H); 7,75 (s a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-206	[CDCl ₃] 1,49 (t, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,14 (m, 2H); 4,38 (m, 2H); 6,90 (s, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,43 (m, 2H); 7,54 (s, 2H).
1.20-207	3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 4,33-4,46 (m, 2H); 4,68 (c, 2H); 7,01 (s a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,53 (s, 1H); 7,55 (s, 2H); 7,56 (s, 1H).
1.20-208	[CDCl ₃] 3,34 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 4,38-4,48 (m, 4H); 5,93-6,21 (tt, 1H); 6,98 (s, 1H); 7,42 (m, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,54 (m, 3H).
1.20-210	[CDCl ₃] 0,98-1,08 (m, 2H); 1,09-1,14 (m, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,53-3,60 (m, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,30-4,42 (m, 2H); 6,92 (s a, 1H); 7,44 (s, 2H); 7,46 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-211	[CDCl ₃] 2,24 (s, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,81 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,26-4,38 (m, 2H); 6,82 (s a, 1H); 7,28 (s, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).
1.20-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,33 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,86 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,33 (m, 2H); 6,80 (s, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).
1.20-213	[CDCl ₃] 1,47 (t, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,33 (d, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,03 (s a, 1H); 7,21 (d, 2H); 7,42 (s, 1H).
1.20-241	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,97 (d, 1H); 4,54-4,68 (m, 2H); 6,94 (d, 1H); 7,27 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,57 (s, 2H); 8,19 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.20-242	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,51-4,64 (m, 2H); 7,23 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,57 (s, 2H); 8,36 (s, 1H).
1.20-243	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,96 (d, 1H); 4,51-4,63 (m, 2H); 7,25 (s a, 1H); 7,30 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,57 (s, 2H); 8,46 (s, 1H).
1.20-244	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,91 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,45-4,59 (m, 2H); 6,73 (s, 1H); 7,21 (t a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,23 (s, 1H).
1.20-255	[CDCl ₃] 1,47 (t, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,11 (c, 2H); 4,32 (d, 2H); 7,03 (s a, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
1.20-257	[CDCl ₃] 1,42 (t, 3H); 3,33 (d, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 3,91 (s, 3H); 3,96 (c, 2H); 4,21-4,32 (m, 2H); 7,00 (s a, 1H); 7,20 (s, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).

Datos analíticos tabla 1.25

n.º	RMN
1.25-1	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,41 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 5,60 (s a, 1H); 6,76 (s a, 1H); 7,32 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
1.25-9	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,37 (d, 1H); 3,33-3,46 (m, 1H); 4,02-4,18 (m, 1H); 7,05 (t a, 1H); 7,32 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
1.25-16	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 3,90-4,06 (m, 2H); 5,20 (d, 1H); 5,25 (d, 1H); 5,81-5,92 (m, 1H); 6,84 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
1.25-60	[CDCl ₃] 0,57-0,61 (m, 2H); 0,81-0,87 (m, 2H); 2,78-2,86 (m, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 6,78 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,57 (s, 1H).
1.25-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,59 (t, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,62 (c, 2H); 3,85 (d, 1H); 4,18 (c, 1H); 7,28 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
1.25-96	[CDCl ₃] 1,23-1,32 (m, 6H); 2,50-2,62 (m, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,11-4,21 (m, 2H); 4,33-4,45 (m, 1H); 7,25 (s a, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,52 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
1.25-102	[CDCl ₃] 1,92 (quin, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,36-3,43 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 6,92 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
1.25-110	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,45-4,57 (m, 2H); 7,15 (t a, 1H); 7,32 (d, 1H); 7,34 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,58 (s, 1H); 6,64 (d, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.25-136	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,98 (d, 1H); 4,46-4,60 (m, 2H); 7,17 (d, 1H); 7,33 (s, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,59 (s, 1H); 8,36 (d, 1H).
1.25-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 1H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,32-4,43 (m, 2H); 6,92 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,57 (s, 1H).
1.25-212	[CDCl ₃] 1,45 (t, 3H); 2,24 (s, 3H); 3,32 (d, 1H); 3,33 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,28-4,38 (m, 2H); 6,79 (t a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,57 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

Datos analíticos tabla 1.29

n.º	RMN
1.29-9	[CDCl ₃] 2,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,83-3,90 (m, 2H); 4,02-4,13 (m, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,40 (m, 2H); 7,60 (s, 1H).
1.29-41 D1	[CDCl ₃] D1: 1,63 (d, 3H); 2,37 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (d, 1H); -3,91 (m, 1H); 7,03 (d, 1H); 7,41 (m, 1H); 7,61 (m, 3H).
1.29-41 D2	[CDCl ₃] D2: 1,63 (d, 3H); 2,37 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,95 (d, 1H); 4,93 (quint, 1H); 7,06 (d, 1H); 7,40 (m, 2H); 7,61 (s, 1H).
1.29-48	[CDCl ₃] 1,40 (t, 3H); 2,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,77-3,89 (m, 1H); 4,68-4,76 (m, 1H); 6,86 (m, 1H); 7,41 (m, 2H); 7,61 (1H).
1.29-60	[CDCl ₃] 0,59 (m, 2H); 0,83 (m, 2H); 2,36 (s, 3H); 2,82 (m, 1H); 3,34 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,87 (d, 1H); 6,80 (s, 1H); 7,40 (m, 2H); 7,60 (s, 1H).
1.29-73	[CDCl ₃] 1,88 (m, 1H); 2,28-2,35 (m, 1H); 2,37 (s, 3H); 3,32 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,72 (m, 1H); 3,78-3,88 (m, 3H); 3,98 (c, 1H); 4,55 (m, 1H); 6,93 (d, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,61 (s, 1H).
1.29-93	[CDCl ₃] 2,36 (s, 3H); 2,61 (t, 2H); 3,35 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,62 (c, 2H); 3,72 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 7,40 (m, 2H); 7,60 (s, 1H).
1.29-96	[CDCl ₃] 1,25-1,31 (m, 6H); 2,36 (s, 3H); 2,57 (m, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 4,11-4,20 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 7,22 (s, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,61 (s, 1H);
1.29-136	[CDCl ₃] 2,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,98 (d, 1H); 4,53 (t, 2H); 7,16 (d, 1H); 7,26 (m, 1H); 7,42 (s, 2H); 7,61 (s, 1H); 8,36 (d, 1H).
1.29-137	[CDCl ₃] 2,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,96 (d, 1H); 4,57 (t, 2H); 6,86 (s, 1H); 7,11 (m, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,61 (s, 1H); 8,20 (d, 1H).
1.29-142	[CDCl ₃] 2,37 (s, 3H); 3,37 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 3,93 (s, 3H); 4,46-4,51 (m, 2H); 6,65 (s, 1H); 6,80 (d, 1H); 7,16 (s, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,61 (s, 1H); 8,12 (d, 1H).
1.29-148	[CDCl ₃] 1,30 (t, 3H); 2,37 (s, 3H); 2,82 (c, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,63 (d, 1H); 4,51 (t, 2H); 7,02 (d, 1H); 7,08 (s, 1H); 7,19 (s, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,62 (s, 1H); 8,50 (d, 1H).
1.29-149	[CDCl ₃] 0,97-1,03 (m, 4H); 2,00 (m, 1H); 2,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,94 (d, 1H); 4,49 (m, 2H); 6,96 (d, 1H); 7,05 (s, 1H); 7,14 (s, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,61 (s, 1H); 8,40 (d, 1H).
1.29-150	[CDCl ₃] 0,96 (t, 3H); 1,76 (sext, 2H); 2,37 (s, 3H); 2,75 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,93 (d, 1H); 4,50 (t, 2H); 7,02 (d, 1H); 7,06 (s, 1H); 7,18 (s, 1H); 7,41 (s, 2H); 7,61 (s, 1H); 8,50 (d, 1H).
1.29-152	[CDCl ₃] 2,37 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 3,96 (d, 1H); 4,58-4,64 (m, 2H); 7,30 (s, 1H); 7,44 (m, 3H); 7,61 (d, 2H); 8,70 (d, 1H).
1.29-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 2,36 (s, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,16 (c, 2H); 4,38 (m, 2H); 6,93 (s, 1H); 7,40 (s, 3H); 7,46 (s, 1H); 7,60 (s, 1H).
1.29-207	[CDCl ₃] 2,36 (s, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,40 (t, 2H); 4,67 (c, 2H); 7,03 (s, 1H); 7,41 (m, 2H); 7,53 (s, 1H); 7,56 (s, 1H); 7,61 (s, 1H).
1.29-208	[CDCl ₃] 2,36 (s, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,85 (d, 1H); 4,31-4,50 (m, 4H); 6,07 (tt, 1H); 6,99 (t a, 1H); 7,39 (s, 2H); 7,48 (s, 1H); 7,53 (s, 1H); 7,60 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.29-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 2,36 (s, 3H); 3,34 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 4,07 (c, 2H); 4,33 (m, 2H); 6,80 (s, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,40 (s, 2H); 7,61 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.32

n.º	RMN
1.32-1	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,41 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 5,68 (s a, 1H); 6,66 (s a, 1H); 7,47 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
1.32-9	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 3,85-3,97 (m, 1H); 4,01-4,18 (m, 1H); 7,05 (t a, 1H); 7,48 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
1.32-16	3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 3,90-4,05 (m, 2H); 5,20 (d, 1H); 5,24 (d, 1H); 5,80-5,92 (m, 1H); 6,85 (s a, 1H); 7,47 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
1.32-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 2,81 (m, 1H); 3,32 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 6,78 (s a, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,48 (s, 1H); 7,72 (s, 1H).
1.32-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,59 (t, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,36 (s, 3H); 3,62 (c, 2H); 3,86 (d, 1H); 4,18 (c, 2H); 7,28 (s a, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,48 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
1.32-96	[CDCl ₃] 1,22-1,33 (m, 6H); 2,49-2,12 (m, 2H); 3,33 (d, 1H); 3,37 (d, 1H); 3,84 (d, 1H); 4,10-4,23 (m, 2H); 4,34-4,44 (m, 1H); 7,25 (s a, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
1.32-102	[CDCl ₃] 1,92 (pent, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,35 (d, 1H); 3,40 (s, 3H); 3,35-3,44 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 6,92 (s a, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
1.32-110	[CDCl ₃] 3,34 (d, 1H); 3,37 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 4,46-4,59 (m, 2H); 7,15 (t a, 1H); 7,33 (d, 1H); 7,47 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,64 (d, 1H); 7,73 (s, 1H); 8,35 (s, 1H).
1.32-136	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,39 (s, 3H); 3,99 (d, 1H); 4,48-4,58 (m, 2H); 7,16 (d, 1H); 7,24 (s a, 1H); 7,48 (s, 1H); 7,51 (s, 1H); 7,75 (s, 1H); 8,36 (d, 1H).
1.32-206	[CDCl ₃] 1,48 (t, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,31-4,43 (m, 2H); 6,92 (s a, 1H); 7,41 (s, 1H); 7,47 (s, 2H); 7,48 (s, 1H); 7,72 (s, 1H).
1.32-212	[CDCl ₃] 1,44 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 4,03-4,18 (m, 2H); 4,28-4,38 (m, 2H); 6,79 (s a, 1H); 7,32 (s, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,72 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.33

n.º	RMN
1.33-1	[CDCl ₃] 3,40 (d, 1H); 3,41 (s, 3H); 3,93 (d, 1H); 5,64 (s a, 1H); 6,66 (s a, 1H); 7,84 (s, 1H); 7,85 (s, 1H); 8,01 (s, 1H).
1.33-9	3,38 (s, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,83-3,98 (m, 1H); 3,42 (d, 1H); 4,03-4,18 (m, 1H); 7,06 (s a, 1H); 7,85 (s, 2H); 8,01 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
1.33-16	[CDCl ₃] 3,38 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,91 (d, 1H); 3,91-4,06 (m, 2H); 5,20 (d, 1H); 5,28 (d, 1H); 5,80-5,92 (m, 1H); 6,84 (s a, 1H); 7,83 (s, 1H); 7,84 (s, 1H); 8,00 (s, 1H).
1.33-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 2,81 (m, 1H); 3,35 (s, 3H); 3,36 (d, 1H); 3,91 (d, 1H); 6,79 (s a, 1H); 7,83 (s, 1H); 7,84 (s, 1H); 7,99 (s, 1H).
1.33-94	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 2,56 (t, 2H); 3,37 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,63 (c, 2H); 3,89 (d, 1H); 4,18 (c, 2H); 7,28 (s a, 1H); 7,83 (s, 1H); 7,84 (s, 1H); 8,00 (s, 1H).
1.33-96	[CDCl ₃] 1,24-1,35 (m, 6H); 2,50-2,64 (m, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,89 (d, 1H); 4,12-4,23 (m, 2H); 4,34-4,45 (m, 1H); 7,27 (s a, 1H); 7,83 (s, 1H); 7,85 (s, 1H); 8,00 (s, 1H).
1.33-102	[CDCl ₃] 1,92 (pent, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,39 (s, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,39 (t, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,91 (d, 1H); 6,93 (s a, 1H); 7,83 (s, 1H); 7,85 (s, 1H); 8,00 (s, 1H).
1.33-110	[CDCl ₃] 3,36 (s, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,97 (d, 1H); 4,45-4,59 (m, 2H); 7,15 (t a, 1H); 7,33 (d, 1H); 7,65 (dd, 1H); 7,84 (s, 2H); 8,00 (s, 1H); 8,36 (d, 1H).
1.33-136	[CDCl ₃] 3,39 (s, 3H); 3,41 (d, 1H); 4,03 (d, 1H); 4,49-4,59 (m, 2H); 7,17 (d, 1H); 7,25 (s a, 1H); 7,85 (s, 1H); 7,86 (s, 1H); 8,02 (s, 1H); 8,37 (d, 1H).
1.33-206	[CDCl ₃] 1,49 (t, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,92 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,32-4,43 (m, 2H); 6,92 (s a, 1H); 7,41 (s, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,84 (s, 2H); 8,00 (s, 1H).
1.33-212	[CDCl ₃] 1,46 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,35 (s, 3H); 3,37 (d, 1H); 3,43 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,26-4,38 (m, 2H); 6,79 (s a, 1H); 7,31 (s, 1H); 7,83 (s, 1H); 7,84 (s, 1H); 8,00 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 1.56

n.º	RMN
1.56-260	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 2,70 (c, 2H); 3,47 (s, 3H); 3,53 (d, 1H); 4,03 (d, 1H); 7,28 (d, 2H); 7,61 (d, 2H); 8,51 (s a, 1H).
1.56-261	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 2,70 (c, 2H); 3,48 (s, 3H); 3,55 (d, 1H); 4,01 (d, 1H); 7,27 (d, 2H); 7,61 (d, 2H); 8,57 (s a, 1H).
1.56-262	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 2,70 (c, 2H); 3,47 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 4,08 (d, 1H); 7,20-7,30 (m, 2H); 7,6-7,66 (m, 4H); 8,44 (d, 1H); 9,20 (s a, 1H).
1.56-263	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 2,69 (c, 2H); 3,45 (s, 3H); 3,49 (d, 1H); 4,00 (d, 1H); 7,27 (d, 2H); 7,62 (m, 4H); 7,75 (d, 2H); 8,67 (s a, 1H).

Datos analíticos tabla 1.57

n.º	RMN
1.57-264	[CDCl ₃] 3,37 (d, 1H); 3,60 (s, 3H); 4,05 (d, 1H); 7,23 (d, 2H); 7,36 (d, 1H); 7,51 (d, 1H); 7,67 (d, 2H); 8,58 (s a, 1H).
1.57-265	[CDCl ₃] 3,36 (d, 1H); 3,59 (s, 3H); 4,05 (d, 1H); 7,36 (d, 1H); 7,45-7,56 (m, 5H) 8,53 (s a, 1H).

ES 2 607 889 T3

Datos analíticos tabla 2.2

n.º	RMN
2.2-1	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,63 (m, 2H); 3,86 (d, 1H); 5,70 (s a, 1H); 6,70 (s a, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,40 (m, 3H).
2.2-9	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 3,43 (d, 1H); 3,60 (c, 2H); 3,82 (d, 1H); 3,90 (m, 1H); 4,03-4,14 (m, 1H); 7,10 (s a, 1H); 7,13-7,18 (m, 1H); 7,40 (m, 3H).
2.2-16	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,60 (m, 2H); 3,85 (d, 1H); 3,90-4,02 (m, 2H); 5,17-5,27 (m, 2H); 5,87 (m, 1H); 6,90 (s a, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,40 (m, 3H).
2.2-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,82 (m, 2H); 1,24 (t, 3H); 2,80 (m, 2H); 3,40 (d, 1H); 3,58 (m, 2H); 3,82 (d, 1H); 6,82 (s a, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,41 (m, 2H).
2.2-94	[CDCl ₃] 1,26 (m, 6H); 2,59 (t, 2H); 3,39 (d, 1H); 3,60 (m, 4H); 3,82 (d, 1H); 4,18 (c, 2H); 7,14 (m, 1H); 7,31 (s a, 1H); 7,40 (m, 3H).
2.2-96	[CDCl ₃] 1,23-1,31 (m, 9H); 2,56 (m, 2H); 3,40 (d, 1H). 3,60 (m, 2H); 3,80 (d, 1H); 4,18 (m, 2H); 4,40 (m, 1H); 7,13 (m, 1H); 7,27 (s a, 1H); 7,40 (m, 3H).
2.2-102	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 1,92 (quin, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,39 (m, 3H); 3,57 (m, 2H); 3,70 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 6,98 (s a, 1H); 7,16 (m, 1H); 7,40 (m, 3H).
2.2-206	[CDCl ₃] 1,24 (t, 3H); 1,48 (t, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,58 (m, 2H); 3,84 (d, 1H); 4,16 (c, 2H); 4,39 (d, 2H); 6,98 (s a, 1H); 7,12 (m, 1H); 7,40 (m, 4H); 7,46 (s, 1H).
2.2-212	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,44 (m, 3H); 2,26 (s, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,58 (m, 2H); 3,82 (d, 1H); 4,08 (m, 2H); 4,33 (d, 2H); 6,85 (s a, 1H); 7,15 (m, 1H); 7,30 (s, 1H); 7,40 (m, 3H).

Datos analíticos tabla 2.5

n.º	RMN
2.5-9	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,40 (s, 3H); 3,48 (d, 1H); 3,60 (c, 2H); 3,83 (d, 1H); 3,86-3,95 (m, 1H). 4,05-4,12 (m, 1H); 7,10 (s a, 1H); 7,30 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
2.5-16	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,61 (c, 2H); 3,85 (d, 1H); 3,92-4,02 (m, 2H); 5,17-5,30 (m, 2H); 5,82-5,92 (m, 1H); 6,90 (s a, 1H); 7,24-7,33 (m, 2H); 7,44 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
2.5-60	[CDCl ₃] 0,58 (m, 2H); 0,84 (m, 2H); 1,23 (t, 3H); 2,39 (s, 3H); 2,82 (m, 1H); 3,40 (d, 1H); 3,58 (m, 2H); 3,84 (d, 1H); 6,85 (s a, 1H); 7,24-7,32 (m, 2H); 7,43 (d, 1H); 7,50 (s, 1H).
2.5-94	[CDCl ₃] 1,22-1,29 (m, 6H); 2,38 (s, 3H); 2,61 (t, 2H); 3,42 (d, 1H); 3,55-3,63 (m, 4H); 3,84 (d, 1H); 4,19 (c, 2H); 7,24-7,32 (m, 3H); 7,44 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
2.5-96	[CDCl ₃] 1,22-1,31 (m, 9H); 2,38 (s, 3H); 2,57 (m, 2H); 3,40 (d, 1H); 3,60 (m, 2H); 3,80 (d, 1H); 4,11-4,20 (m, 2H); 4,43 (m, 1H); 7,24-7,32 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
2.5-102	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 1,91 (quin, 2H); 2,39 (m, 5H); 3,36-3,44 (m, 3H); 3,57 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,84 (d, 1H); 6,98 (s a, 1H); 7,24-7,33 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
2.5-206	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,48 (t, 3H); 2,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,57 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,38 (d, 2H); 6,99 (s a, 1H); 7,22-7,32 (m, 2H); 7,40-7,46 (m, 3H); 7,50 (s, 1H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
2.5-212	[CDCl ₃] 1,22 (t, 3H); 1,45 (t, 3H); 2,26 (s, 3H); 2,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,58 (m, 2H); 3,84 (d, 1H); 4,07 (m, 2H); 4,32 (d, 2H); 6,86 (s a, 1H); 7,22-7,30 (m, 3H); 7,43 (m, 1H); 7,50 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 2.11

n.º	RMN
2.11-4	[CDCl ₃] 0,98 (t, 3H); 1,27 (t, 3H); 1,62 (c, 2H); 3,22-3,38 (m, 2H); 3,37 (d, 1H); 3,52-3,65 (m, 2H); 3,80 (d, 1H); 6,80 (s a, 1H); 6,89 (t, 1H); 7,19 (d, 2H).
2.11-9	[CDCl ₃] 1,29 (t, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,53-3,65 (m, 2H); 3,82 (d, 1H); 3,85-3,98 (m, 1H); 4,01-4,15 (m, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,05 (t a, 1H); 7,20 (d, 2H).
2.11-60	[CDCl ₃] 0,59 (t, 2H); 0,87 (m, 2H); 1,26 (t, 3H); 2,81 (m, 1H); 3,32 (d, 1H); 3,50-3,63 (m, 2H); 3,82 (d, 1H); 6,80 (s a, 1H); 6,89 (t, 1H); 7,18 (d, 2H).
2.11-93	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,60 (t, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,50-3,60 (m, 2H); 3,62 (c, 2H); 3,71 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 6,89 (t, 1H); 7,18 (d, 2H); 7,28 (t a, 1H).
2.11-96	[CDCl ₃] 1,22-1,36 (m, 9H); 2,50-2,61 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,53-3,65 (m, 2H); 3,80 (d, 1H); 4,11-4,22 (m, 2H); 4,34-4,45 (m, 1H); 6,89 (t, 1H); 7,18 (d, 2H); 7,25 (s a, 1H).
2.11-102	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 1,93 (c, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,40 (c, 2H); 3,51-3,65 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 6,85-6,93 (m, 1H); 6,95 (t a, 1H); 7,19 (d, 2H).
2.11-135	[CDCl ₃] 1,28 (t, 3H); 3,38 (d, 1H); 3,50-3,70 (m, 2H); 3,95 (d, 1H); 4,62 (t, 2H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H); 7,38 (t a, 1H); 7,45 (d, 2H); 8,68 (d, 2H).
2.11-206	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 1,49 (t, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,50-3,63 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,38 (d, 2H); 6,89 (t, 1H); 6,95 (t a, 1H); 7,18 (d, 2H); 7,40 (s, 1H); 7,46 (s, 1H).
2.11-212	[CDCl ₃] 1,24 (t, 3H); 1,48 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,35 (d, 1H); 3,50-3,64 (m, 2H); 3,85 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,34 (d, 2H); 6,82 (t, 1H); 6,90 (t, 1H); 7,18 (d, 2H); 7,32 (s, 1H).

Datos analíticos tabla 2.20

n.º	RMN
2.20-4	[CDCl ₃] 0,96 (t, 3H); 1,25 (t, 3H); 1,55-1,64 (m, 2H); 3,23-3,35 (m, 2H); 3,34 (d, 1H); 3,51-3,65 (m, 2H); 3,80 (d, 1H); 6,79 (t a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
2.20-9	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,52-3,65 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 3,83-3,97 (m, 1H); 4,01-4,18 (m, 1H); 7,05 (t a, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
2.20-60	[CDCl ₃] 0,60 (m, 2H); 0,85 (m, 2H); 1,24 (t, 3H); 2,80 (m, 1H); 3,32 (d, 1H); 3,50-3,63 (m, 2H); 3,84 (d, 1H); 6,80 (s a, 1H); 7,42 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).
2.20-93	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,61 (t, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,50-3,65 (m, 4H); 3,72 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 7,30 (t a, 1H); 7,42 (s, 1H); 7,55 (d, 2H).
2.20-96	[CDCl ₃] 1,23-1,31 (m, 9H); 2,55 (m, 2H); 3,31 (d, 1H); 3,57 (m, 2H); 3,80 (d, 1H); 4,14 (m, 2H); 4,39 (m, 1H); 7,28 (s a, 1H); 7,42 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).

(continuación)

n.º	RMN
2.20-102	[CDCl ₃] 1,26 (t, 3H); 1,92 (quin, 2H); 2,40 (t, 2H); 3,32 (d, 1H); 3,39 (c, 2H); 3,50-3,64 (m, 2H); 3,69 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 6,96 (t a, 1H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
2.20-135	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 3,39 (d, 1H); 3,52-3,67 (m, 2H); 3,93 (d, 1H); 4,55 (d, 2H); 7,23 (m, 3H); 7,44 (s, 1H); 7,56 (s, 2H); 8,60 (d, 2H).
2.20-206	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 1,50 (t, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,50-3,64 (m, 2H); 3,85 (d, 1H); 4,15 (c, 2H); 4,38 (d, 2H); 6,95 (t a, 1H); 7,40 (s, 1H); 7,44 (s, 1H); 7,48 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
2.20-212	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,43 (t, 3H); 2,26 (s, 3H); 3,34 (d, 1H); 3,48-3,64 (m, 2H); 3,83 (d, 1H); 4,08 (c, 2H); 4,33 (d, 2H); 6,82 (s a, 1H); 7,32 (s, 1H); 7,42 (s, 1H); 7,54 (s, 2H).
3.11-9	[CDCl ₃] 3,41 (s, 3H); 3,57 (d, 1H); 4,08 (d, 1H); 4,34 (m, 1H); 4,62 (m, 1H); 6,91 (m, 1H); 7,20 (m, 2H); 8,70 (s a, 1H).
3.11-60	[CDCl ₃] 0,73 (m, 2H); 1,01 (m, 2H); 3,30 (m, 1H); 3,38 (s, 3H); 3,54 (d, 1H); 4,10 (d, 1H); 6,90 (m, 1H); 7,19 (m, 2H); 8,50 (s a, 1H).
3.11-93	[CDCl ₃] 2,76 (m, 2H); 3,38 (s, 3H); 3,51 (d, 1H); 3,73 (s, 3H); 4,02 (m, 2H); 4,10 (d, 1H); 6,90 (m, 1H); 7,20 (m, 2H); 9,12 (s a, 1H).
3.11-212	[CDCl ₃] 1,47 (t, 3H); 2,25 (s, 3H); 3,38 (s, 3H); 3,55 (d, 1H); 4,09-4,14 (m, 3H); 4,63 (m, 2H); 6,90 (m, 1H); 7,19 (m, 2H); 7,39 (s, 1H); 8,50 (s a, 1H).

La tabla A describe compuestos de la fórmula general (II) en la que R¹ y R² son en cada caso hidrógeno y los restos X², X³, X⁴, X⁵, X⁶, R³ y V tienen el significado indicado en la tabla.

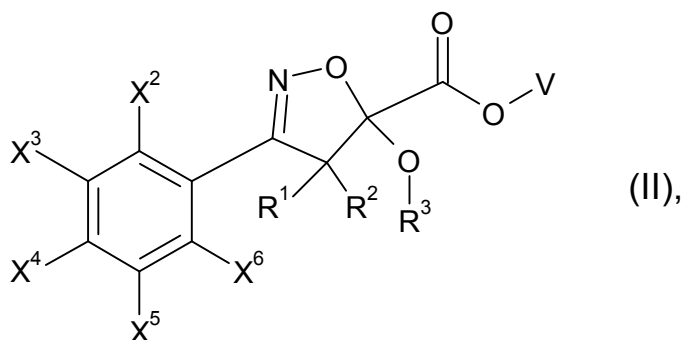


Tabla A: intermedios

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-1	H	H	H	H	H	Me	H
A-2	H	H	H	H	H	Me	Me
A-3	H	H	H	H	H	Me	Et
A-4	H	H	H	H	H	Et	H
A-5	H	H	H	H	H	Et	Me
A-6	H	H	H	H	H	Et	Et
A-7	H	H	H	F	H	Me	H

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ⁵	V
A-8	H	H	H	F	H	Me	Me
A-9	H	H	H	F	H	Me	Et
A-10	H	H	H	F	H	Et	H
A-11	H	H	H	F	H	Et	Me
A-12	H	H	H	F	H	Et	Et
A-13	H	H	H	Cl	H	Me	H
A-14	H	H	H	Cl	H	Me	Me
A-15	H	H	H	Cl	H	Me	Et
A-16	H	H	H	Cl	H	Et	H
A-17	H	H	H	Cl	H	Et	Me
A-18	H	H	H	Cl	H	Et	Et
A-19	H	H	H	Br	H	Me	H
A-20	H	H	H	Br	H	Me	Me
A-21	H	H	H	Br	H	Me	Et
A-22	H	H	H	Br	H	Et	H
A-23	H	H	H	Br	H	Et	Me
A-24	H	H	H	Br	H	Et	Et
A-25	H	H	H	Me	H	Me	H
A-26	H	H	H	Me	H	Me	Me
A-27	H	H	H	Me	H	Me	Et
A-28	H	H	H	Me	H	Et	H
A-29	H	H	H	Me	H	Et	Me
A-30	H	H	H	Me	H	Et	Et
A-31	H	H	H	Et	H	Me	H
A-32	H	H	H	Et	H	Me	Me
A-33	H	H	H	Et	H	Me	Et
A-34	H	H	H	Et	H	Et	H
A-35	H	H	H	Et	H	Et	Me
A-36	H	H	H	Et	H	Et	Et
A-37	H	H	H	OMe	H	Me	H
A-38	H	H	H	OMe	H	Me	Me
A-39	H	H	H	OMe	H	Me	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-40	H	H	H	OMe	H	Et	H
A-41	H	H	H	OMe	H	Et	Me
A-42	H	H	H	OMe	H	Et	Et
A-43	H	H	H	OCF ₃	H	Me	H
A-44	H	H	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-45	H	H	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-46	H	H	H	OCF ₃	H	Et	H
A-47	H	H	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-48	H	H	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-49	H	H	H	CF ₃	H	Me	H
A-50	H	H	H	CF ₃	H	Me	Me
A-51	H	H	H	CF ₃	H	Me	Et
A-52	H	H	H	CF ₃	H	Et	H
A-53	H	H	H	CF ₃	H	Et	Me
A-54	H	H	H	CF ₃	H	Et	Et
A-55	H	H	H	CN	H	Me	H
A-56	H	H	H	CN	H	Me	Me
A-57	H	H	H	CN	H	Me	Et
A-58	H	H	H	CN	H	Et	H
A-59	H	H	H	CN	H	Et	Me
A-60	H	H	H	CN	H	Et	Et
A-61	H	F	H	F	H	Me	H
A-62	H	F	H	F	H	Me	Me
A-63	H	F	H	F	H	Me	Et
A-64	H	F	H	F	H	Et	H
A-65	H	F	H	F	H	Et	Me
A-66	H	F	H	F	H	Et	Et
A-67	H	F	H	Cl	H	Me	H
A-68	H	F	H	Cl	H	Me	Me
A-69	H	F	H	Cl	H	Me	Et
A-70	H	F	H	Cl	H	Et	H
A-71	H	F	H	Cl	H	Et	Me
A-72	H	F	H	Cl	H	Et	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-73	H	F	H	Br	H	Me	H
A-74	H	F	H	Br	H	Me	Me
A-75	H	F	H	Br	H	Me	Et
A-76	H	F	H	Br	H	Et	H
A-77	H	F	H	Br	H	Et	Me
A-78	H	F	H	Br	H	Et	Et
A-79	H	F	H	Me	H	Me	H
A-80	H	F	H	Me	H	Me	Me
A-81	H	F	H	Me	H	Me	Et
A-82	H	F	H	Me	H	Et	H
A-83	H	F	H	Me	H	Et	Me
A-84	H	F	H	Me	H	Et	Et
A-85	H	F	H	Et	H	Me	H
A-86	H	F	H	Et	H	Me	Me
A-87	H	F	H	Et	H	Me	Et
A-88	H	F	H	Et	H	Et	H
A-89	H	F	H	Et	H	Et	Me
A-90	H	F	H	Et	H	Et	Et
A-91	H	F	H	OMe	H	Me	H
A-92	H	F	H	OMe	H	Me	Me
A-93	H	F	H	OMe	H	Me	Et
A-94	H	F	H	OMe	H	Et	H
A-95	H	F	H	OMe	H	Et	Me
A-96	H	F	H	OMe	H	Et	Et
A-97	H	F	H	OCF ₃	H	Me	H
A-98	H	F	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-99	H	F	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-100	H	F	H	OCF ₃	H	Et	H
A-101	H	F	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-102	H	F	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-103	H	F	H	CF ₃	H	Me	H
A-104	H	F	H	CF ₃	H	Me	Me
A-105	H	F	H	CF ₃	H	Me	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-106	H	F	H	CF ₃	H	Et	H
A-107	H	F	H	CF ₃	H	Et	Me
A-108	H	F	H	CF ₃	H	Et	Et
A-109	H	F	H	CN	H	Me	H
A-110	H	F	H	CN	H	Me	Me
A-111	H	F	H	CN	H	Me	Et
A-112	H	F	H	CN	H	Et	H
A-113	H	F	H	CN	H	Et	Me
A-114	H	F	H	CN	H	Et	Et
A-115	H	Cl	H	Cl	H	Me	H
A-116	H	Cl	H	Cl	H	Me	Me
A-117	H	Cl	H	Cl	H	Me	Et
A-118	H	Cl	H	Cl	H	Et	H
A-119	H	Cl	H	Cl	H	Et	Me
A-120	H	Cl	H	Cl	H	Et	Et
A-121	H	Cl	H	Br	H	Me	H
A-122	H	Cl	H	Br	H	Me	Me
A-123	H	Cl	H	Br	H	Me	Et
A-124	H	Cl	H	Br	H	Et	H
A-125	H	Cl	H	Br	H	Et	Me
A-126	H	Cl	H	Br	H	Et	Et
A-127	H	Cl	H	Me	H	Me	H
A-128	H	Cl	H	Me	H	Me	Me
A-129	H	Cl	H	Me	H	Me	Et
A-130	H	Cl	H	Me	H	Et	H
A-131	H	Cl	H	Me	H	Et	Me
A-132	H	Cl	H	Me	H	Et	Et
A-133	H	Cl	H	Et	H	Me	H
A-134	H	Cl	H	Et	H	Me	Me
A-135	H	Cl	H	Et	H	Me	Et
A-136	H	Cl	H	Et	H	Et	H
A-137	H	Cl	H	Et	H	Et	Me
A-138	H	Cl	H	Et	H	Et	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-139	H	Cl	H	OMe	H	Me	H
A-140	H	Cl	H	OMe	H	Me	Me
A-141	H	Cl	H	OMe	H	Me	Et
A-142	H	Cl	H	OMe	H	Et	H
A-143	H	Cl	H	OMe	H	Et	Me
A-144	H	Cl	H	OMe	H	Et	Et
A-145	H	Cl	H	OCF ₃	H	Me	H
A-146	H	Cl	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-147	H	Cl	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-148	H	Cl	H	OCF ₃	H	Et	H
A-149	H	Cl	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-150	H	Cl	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-151	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	H
A-152	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	Me
A-153	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	Et
A-154	H	Cl	H	CF ₃	H	Et	H
A-155	H	Cl	H	CF ₃	H	Et	Me
A-156	H	Cl	H	CF ₃	H	Et	Et
A-157	H	Cl	H	CN	H	Me	H
A-158	H	Cl	H	CN	H	Me	Me
A-159	H	Cl	H	CN	H	Me	Et
A-160	H	Cl	H	CN	H	Et	H
A-161	H	Cl	H	CN	H	Et	Me
A-162	H	Cl	H	CN	H	Et	Et
A-163	H	Br	H	Br	H	Me	H
A-164	H	Br	H	Br	H	Me	Me
A-165	H	Br	H	Br	H	Me	Et
A-166	H	Br	H	Br	H	Et	H
A-167	H	Br	H	Br	H	Et	Me
A-168	H	Br	H	Br	H	Et	Et
A-169	H	Br	H	Me	H	Me	H
A-170	H	Br	H	Me	H	Me	Me
A-171	H	Br	H	Me	H	Me	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-172	H	Br	H	Me	H	Et	H
A-173	H	Br	H	Me	H	Et	Me
A-174	H	Br	H	Me	H	Et	Et
A-175	H	Br	H	Et	H	Me	H
A-176	H	Br	H	Et	H	Me	Me
A-177	H	Br	H	Et	H	Me	Et
A-178	H	Br	H	Et	H	Et	H
A-179	H	Br	H	Et	H	Et	Me
A-180	H	Br	H	Et	H	Et	Et
A-181	H	Br	H	OMe	H	Me	H
A-182	H	Br	H	OMe	H	Me	Me
A-183	H	Br	H	OMe	H	Me	Et
A-184	H	Br	H	OMe	H	Et	H
A-185	H	Br	H	OMe	H	Et	Me
A-186	H	Br	H	OMe	H	Et	Et
A-187	H	Br	H	OCF ₃	H	Me	H
A-188	H	Br	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-189	H	Br	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-190	H	Br	H	OCF ₃	H	Et	H
A-191	H	Br	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-192	H	Br	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-193	H	Br	H	CF ₃	H	Me	H
A-194	H	Br	H	CF ₃	H	Me	Me
A-195	H	Br	H	CF ₃	H	Me	Et
A-196	H	Br	H	CF ₃	H	Et	H
A-197	H	Br	H	CF ₃	H	Et	Me
A-198	H	Br	H	CF ₃	H	Et	Et
A-199	H	Br	H	CN	H	Me	H
A-200	H	Br	H	CN	H	Me	Me
A-201	H	Br	H	CN	H	Me	Et
A-202	H	Br	H	CN	H	Et	H
A-203	H	Br	H	CN	H	Et	Me
A-204	H	Br	H	CN	H	Et	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-205	H	Me	H	Me	H	Me	H
A-206	H	Me	H	Me	H	Me	Me
A-207	H	Me	H	Me	H	Me	Et
A-208	H	Me	H	Me	H	Et	H
A-209	H	Me	H	Me	H	Et	Me
A-210	H	Me	H	Me	H	Et	Et
A-211	H	Me	H	Et	H	Me	H
A-212	H	Me	H	Et	H	Me	Me
A-213	H	Me	H	Et	H	Me	Et
A-214	H	Me	H	Et	H	Et	H
A-215	H	Me	H	Et	H	Et	Me
A-216	H	Me	H	Et	H	Et	Et
A-217	H	Me	H	OMe	H	Me	H
A-218	H	Me	H	OMe	H	Me	Me
A-219	H	Me	H	OMe	H	Me	Et
A-220	H	Me	H	OMe	H	Et	H
A-221	H	Me	H	OMe	H	Et	Me
A-222	H	Me	H	OMe	H	Et	Et
A-223	H	Me	H	OCF ₃	H	Me	H
A-224	H	Me	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-225	H	Me	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-226	H	Me	H	OCF ₃	H	Et	H
A-227	H	Me	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-228	H	Me	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-229	H	Me	H	CF ₃	H	Me	H
A-230	H	Me	H	CF ₃	H	Me	Me
A-231	H	Me	H	CF ₃	H	Me	Et
A-232	H	Me	H	CF ₃	H	Et	H
A-233	H	Me	H	CF ₃	H	Et	Me
A-234	H	Me	H	CF ₃	H	Et	Et
A-235	H	Me	H	CN	H	Me	H
A-236	H	Me	H	CN	H	Me	Me
A-237	H	Me	H	CN	H	Me	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-238	H	Me	H	CN	H	Et	H
A-239	H	Me	H	CN	H	Et	Me
A-240	H	Me	H	CN	H	Et	Et
A-241	H	Et	H	Et	H	Me	H
A-242	H	Et	H	Et	H	Me	Me
A-243	H	Et	H	Et	H	Me	Et
A-244	H	Et	H	Et	H	Et	H
A-245	H	Et	H	Et	H	Et	Me
A-246	H	Et	H	Et	H	Et	Et
A-247	H	Et	H	OMe	H	Me	H
A-248	H	Et	H	OMe	H	Me	Me
A-249	H	Et	H	OMe	H	Me	Et
A-250	H	Et	H	OMe	H	Et	H
A-251	H	Et	H	OMe	H	Et	Me
A-252	H	Et	H	OMe	H	Et	Et
A-253	H	Et	H	OCF ₃	H	Me	H
A-254	H	Et	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-255	H	Et	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-256	H	Et	H	OCF ₃	H	Et	H
A-257	H	Et	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-258	H	Et	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-259	H	Et	H	CF ₃	H	Me	H
A-260	H	Et	H	CF ₃	H	Me	Me
A-261	H	Et	H	CF ₃	H	Me	Et
A-262	H	Et	H	CF ₃	H	Et	H
A-263	H	Et	H	CF ₃	H	Et	Me
A-264	H	Et	H	CF ₃	H	Et	Et
A-265	H	Et	H	CN	H	Me	H
A-266	H	Et	H	CN	H	Me	Me
A-267	H	Et	H	CN	H	Me	Et
A-268	H	Et	H	CN	H	Et	H
A-269	H	Et	H	CN	H	Et	Me
A-270	H	Et	H	CN	H	Et	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-271	H	OMe	H	OMe	H	Me	H
A-272	H	OMe	H	OMe	H	Me	Me
A-273	H	OMe	H	OMe	H	Me	Et
A-274	H	OMe	H	OMe	H	Et	H
A-275	H	OMe	H	OMe	H	Et	Me
A-276	H	OMe	H	OMe	H	Et	Et
A-277	H	OMe	H	OCF ₃	H	Me	H
A-278	H	OMe	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-279	H	OMe	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-280	H	OMe	H	OCF ₃	H	Et	H
A-281	H	OMe	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-282	H	OMe	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-283	H	OMe	H	CF ₃	H	Me	H
A-284	H	OMe	H	CF ₃	H	Me	Me
A-285	H	OMe	H	CF ₃	H	Me	Et
A-286	H	OMe	H	CF ₃	H	Et	H
A-287	H	OMe	H	CF ₃	H	Et	Me
A-288	H	OMe	H	CF ₃	H	Et	Et
A-289	H	OMe	H	CN	H	Me	H
A-290	H	OMe	H	CN	H	Me	Me
A-291	H	OMe	H	CN	H	Me	Et
A-292	H	OMe	H	CN	H	Et	H
A-293	H	OMe	H	CN	H	Et	Me
A-294	H	OMe	H	CN	H	Et	Et
A-295	H	OCF ₃	H	OCF ₃	H	Me	H
A-296	H	OCF ₃	H	OCF ₃	H	Me	Me
A-297	H	OCF ₃	H	OCF ₃	H	Me	Et
A-298	H	OCF ₃	H	OCF ₃	H	Et	H
A-299	H	OCF ₃	H	OCF ₃	H	Et	Me
A-300	H	OCF ₃	H	OCF ₃	H	Et	Et
A-301	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	Me	H
A-302	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	Me	Me
A-303	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	Me	Et

(continuación)

n.º	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	R ³	V
A-304	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	Et	H
A-305	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	Et	Me
A-306	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	Et	Et
A-307	H	OCF ₃	H	CN	H	Me	H
A-308	H	OCF ₃	H	CN	H	Me	Me
A-309	H	OCF ₃	H	CN	H	Me	Et
A-310	H	OCF ₃	H	CN	H	Et	H
A-311	H	OCF ₃	H	CN	H	Et	Me
A-312	H	OCF ₃	H	CN	H	Et	Et
A-313	H	CF ₃	H	CF ₃	H	Me	H
A-314	H	CF ₃	H	CF ₃	H	Me	Me
A-315	H	CF ₃	H	CF ₃	H	Me	Et
A-316	H	CF ₃	H	CF ₃	H	Et	H
A-317	H	CF ₃	H	CF ₃	H	Et	Me
A-318	H	CF ₃	H	CF ₃	H	Et	Et
A-319	H	CF ₃	H	CN	H	Me	H
A-320	H	CF ₃	H	CN	H	Me	Me
A-321	H	CF ₃	H	CN	H	Me	Et
A-322	H	CF ₃	H	CN	H	Et	H
A-323	H	CF ₃	H	CN	H	Et	Me
A-324	H	CF ₃	H	CN	H	Et	Et
A-325	H	CN	H	CN	H	Me	H
A-326	H	CN	H	CN	H	Me	Me
A-327	H	CN	H	CN	H	Me	Et
A-328	H	CN	H	CN	H	Et	H
A-329	H	CN	H	CN	H	Et	Me
A-330	H	CN	H	CN	H	Et	Et
A-331	H	H	Et	H	H	Me	H
A-332	H	H	Et	H	H	Me	Me
A-333	H	H	Et	H	H	Me	Et
A-334	Cl	Cl	H	H	Cl	Me	H
A-335	Cl	Cl	H	H	Cl	Me	Me
A-336	Cl	Cl	H	H	Cl	Me	Et

ES 2 607 889 T3

Datos analíticos tabla A:

n.º	RMN
A-1	[CDCl ₃] 3,50 (s, 3H); 3,50-3,55 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 7,45 (m, 3H); 7,68 (m, 2H).
A-2	[CDCl ₃] 3,48 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,42 (m, 3H); 7,68 (m, 2H).
A-7	[CDCl ₃] 3,49 (d, 1H); 3,51 (s, 3H); 3,90 (d, 1H); 7,18 (m, 1H); 7,42-7,51 (m, 2H); 7,60 (m, 1H).
A-8	[CDCl ₃] 3,45 (d, 1H), 3,48 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,16 (m, 1H); 7,37-7,43 (m, 3H).
A-10	[CDCl ₃] 1,27 (m, 3H); 3,50 (d, 1H), 3,77 (c, 2H); 3,88 (d, 1H), 5,74 (s a, 1H); 7,16 (m, 1H), 7,40 (m, 2H); 7,60 (m, 1H).
A-12	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,36 (t, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,70-3,85 (m, 3H); 4,34 (m, 2H); 7,13 (m, 1H); 7,40 (m, 3H).
A-13	[CDCl ₃] 3,49 (d, 1H); 3,50 (s, 3H), 3,89 (d, 1H); 7,39 (t, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,56 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
A-14	[CDCl ₃] 3,43 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,37 (t, 1H); 7,41 (m, 1H); 7,54 (m, 1H); 7,67 (m, 1H).
A-25	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,50 (s, 3H); 3,54 (d, 1H); 3,88 (d, 1H); 7,30-7,68 (m, 4H).
A-26	[CDCl ₃] 2,38 (s, 3H); 3,47 (s, 3H); 3,44-3,49 (d, 1H); 3,83 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,25-7,33 (m, 2H), 7,45 (d, 1H); 7,51 (s, 1H).
A-30	[CDCl ₃] 1,22 (t, 3H); 1,35 (t, 3H); 2,39 (s, 3H); 3,49 (d, 1H); 3,70-3,81 (m, 3H); 4,33 (m, 2H); 7,24-7,32 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,52 (s, 1H).
A-31	[CDCl ₃] 1,25 (m, 3H); 2,69 (c, 2H), 3,49 (s, 3H); 3,50 (d, 1H); 3,90 (d, 1H), 7,30 (d, 1H); 7,33 (t, 1H); 7,46 (d, 1H); 7,54 (s, 1H).
A-32	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 3,45-3,50 (d, 1H), 3,47 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,88 (s, 3H); 7,26-7,35 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,54 (s, 1H).
A-36	[CDCl ₃] 1,23 (m, 6H); 1,35 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 3,49 (d, 1H); 3,70-3,85 (m, 3H); 4,43 (m, 2H); 7,29-7,35 (m, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,55 (s, 1H).
A-37	[CDCl ₃] 3,50 (s, 3H); 3,51 (d, 1H); 3,83 (s, 3H); 3,90 (d, 1H); 7,01 (d, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,28 (s, 1H); 7,33 (t, 1H).
A-38	[CDCl ₃] 3,44 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 3,79-3,87 (d, 1H); 3,84 (s, 3H); 3,89 (s, 3H); 6,99 (d, 1H); 7,17 (d, 1H); 7,26-7,34 (m, 2H).
A-42	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,36 (t, 3H), 3,44 (d, 1H); 3,70-3,80 (m, 3H); 3,82 (s, 3H); 4,32 (m, 2H); 6,99 (d, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,28-7,34 (m, 2H).
A-62	[CDCl ₃] 3,40 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 3,78 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 6,90 (t, 1H); 7,20 (d, 2H).
A-61	[CDCl ₃] 3,45 (d, 1H); 3,51 (s, 3H); 3,86 (d, 1H); 6,91 (m, 1H); 7,21 (m, 2H).
A-64	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H); 3,45 (d, 1H), 3,75 (c, 2H); 3,83 (d, 1H); 6,90 (m, 1H); 7,20 (m, 2H).

ES 2 607 889 T3

(continuación)

n.º	RMN
A-66	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,34 (t, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,70-3,77 (m, 2H); 3,82 (m, 1H); 4,35 (m, 2H); 6,89 (m, 1H); 7,20 (m, 2H).
A-79	[CDCl ₃] 2,39 (s, 3H); 3,46 (d, 1H); 3,49 (s, 3H); 3,88 (d, 1H); 6,99 (d, 1H), 7,20 (d, 1H); 7,25 (s, 1H).
A-80	[CDCl ₃] 2,38 (s, 3H); 3,43 (d, 1H), 3,47 (s, 3H); 3,80 (d, 1H), 3,90 (s, 3H); 6,97 (d, 1H); 7,19 (d, 1H); 7,26 (s, 1H).
A-84	[CDCl ₃] 1,22 (t, 3H); 1,35 (t, 3H); 2,39 (s, 3H); 3,42 (d, 1H); 3,72 (m, 2H); 3,80 (quin, 1H); 4,33 (m, 2H); 6,97 (d, 1H); 7,20 (d, 1H), 7,26 (s, 1H).
A-91	[CDCl ₃] 3,47 (d, 1H); 3,50 (s, 3H); 3,83 (s, 3H); 3,85 (d, 1H); 6,71 (d, 1H); 6,96 (d, 1H); 7,02 (s, 1H).
A-92	[CDCl ₃] 3,40 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 3,78 (d, 1H), 3,83 (s, 3H); 3,89 (s, 3H); 6,70 (d, 1H); 6,94 (d, 1H); 7,02 (s, 1H).
A-103	[CDCl ₃] 3,46-3,51 (d, 1H); 3,51 (s, 3H); 3,92 (d, 1H); 7,42 (d, 1H); 7,61 (d, 1H); 7,69 (s, 1H).
A-104	[CDCl ₃] 3,45 (d, 1H); 3,50 (s, 3H); 3,83 (d, 1H); 3,90 (s, 3H); 7,40 (d, 1H); 7,60 (d, 1H), 7,68 (s, 1H).
A-115	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,41 (s, 3H); 3,78 (d, 1H); 7,38 (s, 1H); 7,48 (s, 2H).
A-116	[CDCl ₃] 3,40 (d, 1H); 3,48 (s, 3H); 3,78 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,43 (s, 1H); 7,55 (s, 2H).
A-118	[CDCl ₃] 1,27 (t, 3H), 3,45 (d, 1H); 3,75 (c, 2H); 3,85 (d, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
A-120	[CDCl ₃] 1,23 (t, 3H); 1,37 (t, 3H); 3,40 (d, 1H); 3,70-3,82 (m, 3H); 4,35 (m, 2H); 7,43 (s, 1H); 7,56 (s, 2H).
A-145	[CDCl ₃] 3,45 (d, 1H); 3,50 (s, 3H); 3,87 (d, 1H), 7,33 (s, 1H), 7,46 (s, 1H), 7,59 (s, 1H).
A-146	[CDCl ₃] 3,41 (d, 1H); 3,49 (s, 3H); 3,80 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,31 (s, 1H); 7,45 (s, 1H); 7,58 (s, 1H).
A-169	[CDCl ₃] 2,37 (s, 3H), 3,47 (d, 1H), 3,48 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 7,43 (s, 2H); 7,61 (s, 1H).
A-170	[CDCl ₃] 2,36 (s, 3H); 3,41 (d, 1H), 3,47 (s, 3H), 3,79 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,42 (d, 2H); 7,60 (s, 1H).
A-187	[CDCl ₃] 3,45 (d, 1H); 3,50 (s, 3H); 3,87 (d, 1H); 7,49 (d, 2H); 7,73 (s, 1H).
A-188	[CDCl ₃] 3,41 (d, 1H); 3,49 (s, 3H); 3,79 (d, 1H); 3,89 (s, 3H); 7,47 (s, 1H); 7,50 (s, 1H); 7,73 (s, 1H).
A-193	[CDCl ₃] 3,47 (d, 1H), 3,50 (s, 3H); 3,90 (d, 1H); 7,85 (s, 2H); 8,02 (s, 1H).
A-194	[CDCl ₃] 3,45 (d, 1H); 3,49 (s, 3H); 3,81 (d, 1H); 3,90 (s, 3H); 7,83 (m, 2H); 8,01 (s, 1H).

(continuación)

n.º	RMN
A-331	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,69 (c, 2H); 3,49 (s, 3H); 3,51 (d, 1H); 3,89 (d, 1H); 7,26 (d, 2H); 7,59 (d, 2H); 8,0 (s a, 1H).
A-332	[CDCl ₃] 1,25 (t, 3H); 2,68 (c, 2H); 3,36 (d, 1H); 3,47 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 3,88 (s, 3H); 7,25 (d, 2H); 7,58 (d, 2H).
A-334	[CDCl ₃] 3,39 (d, 1H); 3,61 (s, 3H); 3,91 (d, 1H); 7,36 (d, 1H); 7,51 (d, 1H).
A-335	[CDCl ₃] 3,35 (d, 1H); 3,56 (s, 3H); 3,82 (d, 1H); 3,91 (s, 3H); 7,34 (d, 1H); 7,50 (d, 1H).

B. Ejemplos de formulación

1. Agentes de espolvoreo

5 Un agente de espolvoreo se obtiene mezclando 10 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y triturando un molino de martillo.

2. Polvo dispersable

10 Un polvo humectable fácilmente dispersable en agua se obtiene mezclando 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I), 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de lignosulfonato de potasio y 1 parte en peso de oleoilmetiltaurato de sodio como agente humectante y dispersante y moliendo en un molino de púas.

3. Concentrado de dispersión

15 Un concentrado de dispersión fácilmente dispersable en agua se obtiene mezclando 20 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) con 6 partes en peso de alquilfenolpoliglicoléter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanolpoliglicoléter (8 EO) y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico (intervalo de ebullición por ejemplo aproximadamente 255 hasta por encima de 277 °C) y moliendo en un molino de bolas de fricción hasta una finura de por debajo de 5 micrómetros.

4. Concentrado emulsionable

Un concentrado emulsionable se obtiene a partir de 15 partes en peso de un compuesto de fórmula (I), 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol etoxilado como emulsionante.

20 5. Granulado dispersable en agua

Un granulado dispersable en agua se obtiene mezclando

25 75 partes en peso de un compuesto de fórmula (I),
10 partes en peso de lignosulfonato de calcio,
5 partes en peso de laurilsulfato de sodio,
3 partes en peso de poli(alcohol vinílico) y
7 partes en peso de caolín,

moliendo en un molino de púas y granulando el polvo en un lecho fluidizado pulverizando agua como líquido de granulación.

30 Un granulado dispersable en agua se obtiene también homogenizando y pretriturando, en un molino coloidal, 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I),

35 5 partes en peso de 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato de sodio,
2 partes en peso de oleoilmetiltaurinato de sodio,
1 parte en peso de poli(alcohol vinílico),
17 partes en peso de carbonato de calcio y
50 partes en peso de agua,

luego moliendo en un molino de perlas y atomizando y secando la suspensión obtenida de este modo en una torre de pulverización mediante una boquilla de una sustancia.

C. Ejemplos biológicos

1. Acción herbicida en pre-emergencia contra plantas dañinas

Semillas o partes de rizomas de plantas dañinas mono- y dicotiledóneas se colocan en tierra de arcilla arenosa en
 5 tiestos con un diámetro de 9 a 13 cm y se cubren con tierra. Los herbicidas, formulados como concentrados
 emulsionables o agentes de espolvoreo, se aplican en forma de dispersiones acuosas o suspensiones o emulsiones
 con una dosis de aplicación de agua de, calculado, 300 hasta 800 l en diferentes dosificaciones a la superficie de la
 10 cubierta de tierra. Para el posterior cultivo de las plantas, los tiestos se mantuvieron a continuación en condiciones
 óptimas en un invernadero. Después de dejar estar las plantas de ensayo en el invernadero durante 3 a 4 semanas
 de acuerdo con la invención. Por ejemplo, los compuestos n.º 1.2-7, 1.2-11, 1.2-42, 1.2-46, 1.2-62, 1.2-148, 1.2-202,
 1.3-206, 1.3-110, 1.5-212, 1.6-206, 1.7-9, 1.11-9, 1.11-11, 1.11-16, 1.11-21, 1.11-40, 1.11-41 D1, 1.11-42, 1.11-46
 15 D2, 1.11-147, 1.11-48 D 1, 1.11-48 D2, 1.11-53, 1.11-59, 1.11-60, 1.11-110, 1.11-119, 1.11-136, 1.11-137, 1.11-142,
 1.11-150, 1.11-197, 1.11-199, 1.11-200, 1.11-201, 1.11-202, 1.11-210, 1.11-212, 1.11-229, 1.14-16, 1.14-212, 1.18-
 9, 1.18-16, 1.18-96, 1.18-212, 1.20-7, 1.20-19 D2, 1.20-20, 1.20-21, 1.20-42, 1.20-48 D2, 1.20-55, 1.20-74, 1.20-200,
 1.20-208, 1.25-206, 1.29-73, 1.29-212, 1.32-206, 1.33-212 y 2.11-212 con una dosis de aplicación de 320 gramos
 por hectárea muestran en cada caso al menos 90 % de eficacia contra *Echinochloa crus galli*, *Lolium multiflorum*,
Stellaria media y *Veronica persica*.

2. Acción herbicida en pos-emergencia contra plantas dañinas

Semillas de plantas dañinas mono- y dicotiledóneas se colocan en arcilla arenosa en tiestos de cartón, se cubren
 20 con tierra y se cultivan en un invernadero en buenas condiciones de desarrollo. Dos a tres semanas después de la
 siembra, las plantas de ensayo se tratan en la etapa de tres hojas. Los compuestos de acuerdo con la invención,
 formulados como polvos humectables o como concentrados de emulsión, se pulverizan sobre la superficie de las
 25 partes verdes de las plantas con una dosis de aplicación de agua de, calculado, 600 a 800 l/ha. Después de dejar
 estar las plantas de ensayo en el invernadero durante 3 a 4 semanas en condiciones de desarrollo óptimas, se
 evaluó, mediante valoración visual, la actividad de los compuestos de acuerdo con la invención. Por ejemplo, los
 compuestos n.º 1.2-11, 1.2-53, 1.20-93, 1.2-102, 1.2-138, 1.2-200, 1.3-9, 1.3-206, 1.6-206, 1.7-96, 1.11-11, 1.11-20,
 1.11-40, 1.11-53, 1.11-60, 1.11-93, 1.11-110, 1.11-119, 1.11-200, 1.11-212, 1.11-137, 1.11-142, 1.11-149, 1.14-96,
 1.14-136, 1.16-110, 1.18-96, 1.18-206, 1.20-16, 1.20-40, 1.20-58, 1.20-200, 1.20-208, 1.25-102, 1.25-206, 1.29-73,
 30 1.32-96, 1.33-102, 2.2-102, 2.11-96 y 2.11-212 con una dosis de aplicación de 320 gramos por hectárea muestran
 en cada caso al menos 90 % de eficacia contra *Alopecurus myosuroides* y *Polygonum convolvulus*.

3. Acción fungicida

Ejemplo: ensayo protector *in vivo* *Sphaerotheca fuliginea* (oidio en pepinillos)

Para preparar una preparación de principio activo apropiada, el principio activo se mezcla con
 acetona/Tween/DMSO y se diluye con agua a la concentración apropiada.

35 Plantas de pepinillos (variedad: Vert petit de Paris) se cultivan en sustrato de tierra de puzolana/turba 50/50 a 24 °C
 y se pulverizan en el estadio de cotiledón Z11 con la preparación de principio activo especificada anteriormente. Las
 plantas que sirven como control se tratan con una solución acuosa sin el principio activo.

Después de 24 horas, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000
 40 esporas/ml). Las esporas se recolectan de plantas infestadas. Las plantas inoculadas se colocan a 20 °C /25 °C y a
 60/70 % de humedad relativa.

La evaluación se lleva a cabo 12 días después de la inoculación. 0 % significa un grado de eficacia que corresponde
 al del control, mientras que 100 % significa que no se observa infestación.

Con una dosis de aplicación de 500 ppm se hallan los siguientes grados de eficacia con los siguientes compuestos:

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.3-206	94		1.33-102	100
1.5-206	80		1.32-60	100
1.6-206	94		1.32-96	100
1.7-9	98		1.20-19 D2	100
1.7-206	72		1.20-64	98
1.11-19 D1	100		1.20-206	100

(continuación)

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.11-110	78		1.20-212	100
1.11-238	83		1.20-135	98
1.14-16	100		1.25-9	100
1.14-206	98		1.25-16	95
1.16-60	94		1.25-60	100
1.16-96	78		1.25-110	90
1.16-110	89		1.25-136	100
1.16-136	78		1.32-9	100
1.16-212	94		1.32-16	100
1.18-110	98		1.32-110	100
1.18-212	98		1.32-212	100
1.18-206	95		1.33-9	100
1.33-60	100		1.33-16	100
1.33-96	100		1.33-206	100
1.33-212	100			

Ejemplo 2: ensayo protector *in vivo* Phytophthora infestans (tizón tardío en tomates)

5 Para preparar una preparación de principio activo apropiada, el principio activo se mezcla con acetona/Tween/DMSO y se diluye con agua a la concentración apropiada.

Plantas de tomate (variedad Rentita) se cultivan en sustrato de tierra de puzolana/turba 50/50 a 20-25 °C y se pulverizan en el estadio Z12 con la preparación de principio activo especificada anteriormente. Las plantas que sirven como control se tratan con una solución acuosa sin el principio activo.

10 Después de 24 horas, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (20.000 esporas/ml). Las esporas se recolectan de plantas infestadas. Las plantas inoculadas se colocan a 16-18 °C y en una atmósfera húmeda durante 5 días.

La evaluación se lleva a cabo 5 días después de la infestación. 0 % significa a este respecto un grado de eficacia que corresponde al del control, mientras que un grado de eficacia del 100 % significa que no se observa infestación.

Con una dosis de aplicación de 500 ppm se hallan los siguientes grados de eficacia con los siguientes compuestos:

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.11-19 D1	100		1.18-212	99
1.11-110	100		1.20-19 D2	100
1.11-136	100		1.20-64	100
1.11-238	99		1.20-206	100
1.11-239	100		1.20-212	95
1.11-189	100		1.25-212	100
1.14-110	100		1.33-212	97
1.14-206	100		2.11-206	100

(continuación)

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.16-212	100		2.11-212	98
1.18-206	90		2.20-206	85

Ejemplo 3: ensayo protector *in vivo*, Botrytis cinerea (moho gris en pepinillos)

5 Para preparar una preparación de principio activo apropiada, el principio activo se mezcla con acetona/Tween/DMSO y se diluye con agua a la concentración apropiada.

Plantas de pepinillo (Vert petit de Paris) se cultivan en sustrato de tierra de puzolana/turba 50/50 a 24 °C y se pulverizan en el estadio Z11 con la preparación de principio activo especificado anteriormente. Las plantas que sirven como control se tratan con una solución acuosa sin el principio activo.

10 Después de 24 horas, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de Botrytis cinerea (50.000 esporas/ml). Las esporas se suspenden en una solución de nutrientes que consiste en 10 g/l de PDB, 50 g/l de D-fructosa, 2 g/l de NH₄NO₃ y 1 g/l de KH₂PO₄.

Las plantas de pepinillo inoculadas se incuban a 17 °C y a 80 % de humedad relativa del aire.

La evaluación se lleva a cabo 4-5 días después de la infestación. 0 % significa a este respecto un grado de eficacia que corresponde al del control, mientras que un grado de eficacia del 100 % significa que no se observa infestación.

15 Con una dosis de aplicación de 500 ppm se hallan los siguientes grados de eficacia con los siguientes compuestos:

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.3-110	98		1.20-110	83
1.5-206	100		1.20-135	100
1.6-96	95		1.20-206	100
1.6-110	100		1.20-212	100
1.6-206	100		1.25-9	99
1.7-9	95		1.25-16	100
1.7-110	100		1.25-60	100
1.7-206	99		1.25-110	98
1.11-19 D1	100		1.25-136	79
1.11-110	90		1.25-206	100
1.11-238	100		1.25-212	97
1.11-239	98		1.32-9	100
1.14-16	99		1.32-16	100
1.14-110	100		1.32-60	100
1.14-136	88		1.32-94	95
1.14-206	100		1.32-110	100
1.16-60	100		1.32-102	100
1.16-94	75		1.32-206	96
1.16-96	85		1.32-212	100
1.16-110	100		1.33-9	89

(continuación)

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.16-136	96		1.33-16	100
1.16-212	100		1.33-60	100
1.18-110	91		1.33-96	100
1.18-206	100		1.33-110	81
1.18-212	100		1.33-206	100
1.20-19 D2	100		1.33-212	100
1.20-64	70			

Ejemplo 4: ensayo protector *in vivo*, Septoria tritici (hongo de la mancha de la hoja del trigo)

5 Para preparar una preparación de principio activo apropiada, el principio activo se mezcla con acetona/Tween/DMSO y se diluye con agua a la concentración apropiada.

Plantas de trigo (variedad: Scipion) se cultivan en sustrato de tierra de puzolana/turba 50/50 a 22 °C (12 h)/20 °C (12 h) y se pulverizan en la etapa de 1 hoja (altura 10 cm) con la preparación de principio activo especificada anteriormente. Las plantas de control se tratan con una solución acuosa sin adición de principio activo.

10 Después de 24 horas, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de Septoria tritici crioconservada (500.000 esporas/ml). Las plantas inoculadas se colocan a 18 °C y con una humedad relativa del 100 % durante 72 h y posteriormente con una humedad relativa del aire del 90 % durante otros 21-28 días.

21-28 días después de la inoculación, la evaluación se realiza comparando con las plantas de control. 0 % significa a este respecto un grado de eficacia que corresponde al del control, mientras que un grado de eficacia del 100 % significa que no se observa infestación.

15 Con una dosis de aplicación de 500 ppm se hallan los siguientes grados de eficacia con los siguientes compuestos:

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.3-206	100		2.11-206	83
1.3-110	98		2.11-212	83
1.5-206	100		2.20-206	100
1.6-96	75		1.25-206	100
1.6-110	100		1.25-60	100
1.6-206	100		1.25-212	100
1.7-9	100		1.25-9	100
1.7-110	100		1.25-16	97
1.7-206	100		1.25-110	97
1.11-19 D1	100		1.32-1	98
1.11-110	100		1.32-9	100
1.11-136	100		1.32-16	100
1.11-238	100		1.32-60	100
1.11-239	100		1.32-94	100
1.14-16	100		1.32-96	100

(continuación)

Ejemplo n.º	Eficacia [%]		Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.14-110	100		1.32-102	100
1.14-206	100		1.32-110	100
1.16-60	100		1.32-206	100
1.16-96	88		1.32-212	100
1.16-110	100		1.33-1	100
1.16-212	100		1.33-9	100
1.18-110	100		1.33-16	100
1.18-212	100		1.33-60	100
1.20-19 D2	100		1.33-94	100
1.20-64	100		1.33-96	100
1.20-110	100		1.33-102	100
1.20-135	100		1.33-110	100
1.20-206	83		1.33-206	100
1.20-212	100		1.33-212	100

Ejemplo 5: ensayo de Venturia (manzana)/protector

5	Disolventes:	24,5 partes en peso de acetona
		24,5 partes en peso de dimetilacetamida
	Emulsionante: 1	parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter

Para preparar una preparación de principio activo apropiada, 1 parte en peso del principio activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

10 Para probar la eficacia protectora, las plantas jóvenes se pulverizan con la preparación de principio activo con la dosis de aplicación establecida. Después del secado del revestimiento de pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de conidios del patógeno de la sarna del manzano *Venturia inaequalis* y luego permanecen en una cabina de incubación a aproximadamente 20 °C y 100 % de humedad relativa del aire durante 1 día.

15 A continuación las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 21 °C y una humedad relativa del aire de aproximadamente 90 %. La evaluación se produce 10 días después de la inoculación. 0 % significa a este respecto un grado de eficacia que corresponde al del control, mientras que un grado de eficacia del 100 % significa que no se observa infestación.

En este ensayo, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención muestran, a una concentración de principio activo de 100 ppm, un grado de eficacia del 70 % o más:

20

Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.11-212	100
1.20-5	96
1.25-206	90
1.25-212	98

Ejemplo 6: ensayo de Plasmopara (vid)/protector

Disolventes: 24,5 partes en peso de acetona
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida
 Emulsionante: 1 parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter

5 Para preparar una preparación de principio activo apropiada, 1 parte en peso del principio activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

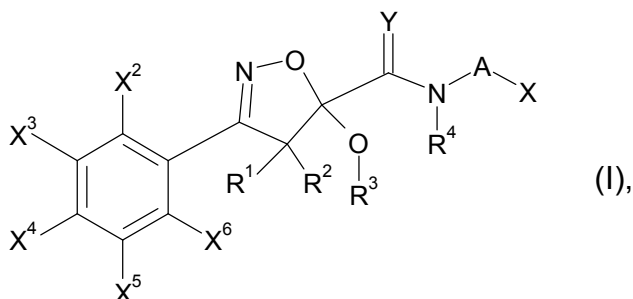
10 Para probar la eficacia protectora, las plantas jóvenes se pulverizan con la preparación de principio activo con la dosis de aplicación establecida. Después del secado del revestimiento de pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Plasmopara viticola* y luego permanecen en una cabina de incubación a aproximadamente 20 °C y 100 % de humedad relativa del aire durante 1 día. A continuación las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 21 °C y una humedad relativa del aire de aproximadamente 90 % durante 4 días. Posteriormente, las plantas se humedecen y se colocan en una cabina de incubación durante 1 día. La evaluación se produce 6 días después de la inoculación. 0 % significa a este respecto un grado de eficacia que corresponde al del control, mientras que un grado de eficacia del 100 % significa que no se observa infestación.

15 En este ensayo, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención muestran, a una concentración de principio activo de 100 ppm, un grado de eficacia del 70 % o más:

Ejemplo n.º	Eficacia [%]
1.20-5	99
1.25-206	98
1.25-212	100

REIVINDICACIONES

1. 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas de fórmula (I) o sus sales



5 en la que

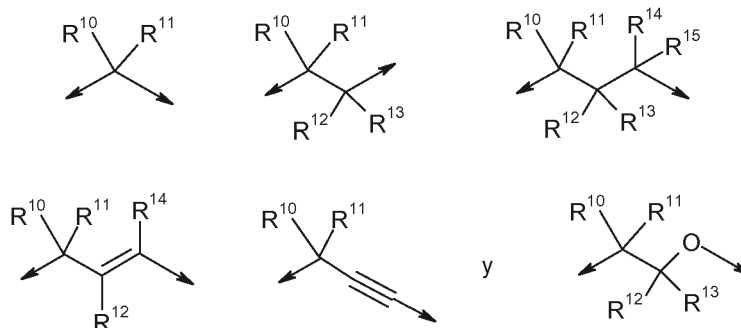
R¹ y R² significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo y ciano

10 R¹ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de tres, cuatro o cinco miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que está formado por q átomos de carbono y p átomos de oxígeno;

R³ significa alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alcoxi (C₁-C₄) e hidroxilo;

15 R⁴ significa hidrógeno, ciano o alquilo (C₁-C₈), cicloalquilo (C₃-C₈), alquenilo (C₃-C₈) o alquinilo (C₃-C₈) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo y alcoxi (C₁-C₆);

A significa un enlace o una unidad divalente del grupo que consiste en



20 R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ y R¹⁵ significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, R⁵,

o alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₅), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,

o alcoxi (C₁-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), alquenilo (C₂-C₆) o alquinilo (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

25 Y significa oxígeno o azufre;

X significa hidrógeno, ciano, hidroxilo, X¹

30 o alquilo (C₁-C₁₂), cicloalquilo (C₃-C₈), alquenilo (C₂-C₁₂) o alquinilo (C₂-C₁₂) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, OR⁷, X¹, OX¹, NHX¹, S(O)_nR⁵, SO₂NR⁶R⁷, SO₂NR⁶COR⁸, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, COR⁶, CONR⁶SO₂R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶COR⁸, NR⁶CONR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, NR⁶SO₂R⁸, NR⁶SO₂NR⁶R⁸, OCONR⁶R⁸, OCSNR⁶R⁸, POR⁹R⁸ y C(R⁶)=NOR⁸

35 X, A y R⁴ con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que contiene, además de este átomo de nitrógeno, k átomos de carbono, n átomos de oxígeno, p átomos de azufre y p elementos del grupo que consiste en NR⁷ y NCOR⁷ como átomos del anillo, donde un átomo de carbono porta p grupos oxo;

X¹ significa un anillo de tres, cuatro, cinco o seis miembros saturado, parcialmente insaturado, totalmente insaturado o aromático que está formado por r átomos de carbono, s átomos de nitrógeno, n átomos de azufre y n átomos de oxígeno, y que está sustituido con s restos del grupo que consiste en R⁶, R^{6a}, R⁸ y R⁹, donde los

átomos de azufre y los átomos de carbono portan n grupos oxo;

o X^1 significa fenilo sustituido con m restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 ;

X^2 , X^4 y X^6 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, o alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_4), alquino (C_2-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenoiloxi (C_2-C_4), alquinoiloxi (C_2-C_4) o alquilcarbonilo (C_1-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C_1-C_4);

X^3 y X^5 significan independientemente entre sí hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, nitro, SF_5 , $CONR^8SO_2R^5$, $CONR^6R^8$, COR^6 , CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, $C(R^6)=NOR^8$, NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$, $NR^6CO_2R^8$, $NR^6SO_2R^8$, $NR^6SO_2NR^6R^8$, $OCOR^6R^8$, OSO_2R^5 , $S(O)_nR^5$, $SO_2NR^6R^8$, $OSO_2NR^6R^8$,

o alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,

o alcoxi (C_1-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_6), alquenoiloxi (C_2-C_6) o alquinoiloxi (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

R^5 significa alquilo (C_1-C_6) o cicloalquilo (C_3-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano e hidroxilo;

R^6 significa hidrógeno o R^5 ;

R^{6a} significa flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, $S(O)_nR^5$ o alcoxi (C_1-C_6), alquenoiloxi (C_3-C_6) o alquinoiloxi (C_3-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

R^7 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_4) o alquino (C_2-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);

R^8 significa R^7 ,

R^9 significa alquilo (C_1-C_3) o alcoxi (C_1-C_3),

k significa 3, 4, 5 o 6;

m significa 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

n significa 0, 1 o 2;

p significa 0 o 1;

q significa 3, 4 o 5;

r significa 1, 2, 3, 4 o 5;

s significa 0, 1, 2, 3 o 4.

2. 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas de acuerdo con la reivindicación 1

en las que

R^1 y R^2 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o alquilo (C_1-C_4) o alcoxi (C_1-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo y ciano

o

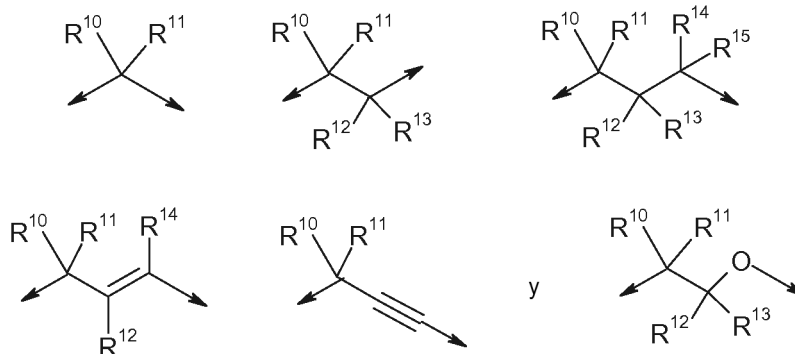
R^1 y R^2 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de tres, cuatro o cinco miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que está formado por q átomos de carbono y p átomos de oxígeno;

R^3 significa alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_6) o alquino (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alcoxi (C_1-C_4) e hidroxilo,

R^4 significa hidrógeno, ciano

o alquilo (C_1-C_8) o cicloalquilo (C_3-C_8) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo y alcoxi (C_1-C_6);

A significa un enlace o una unidad divalente del grupo que consiste en



R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, R^5 o significan alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_6) o alquino (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,

o alcoxi (C₁-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₆), alquenioloxi (C₂-C₆) o alquinioloxi (C₂-C₆) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C₁-C₂);

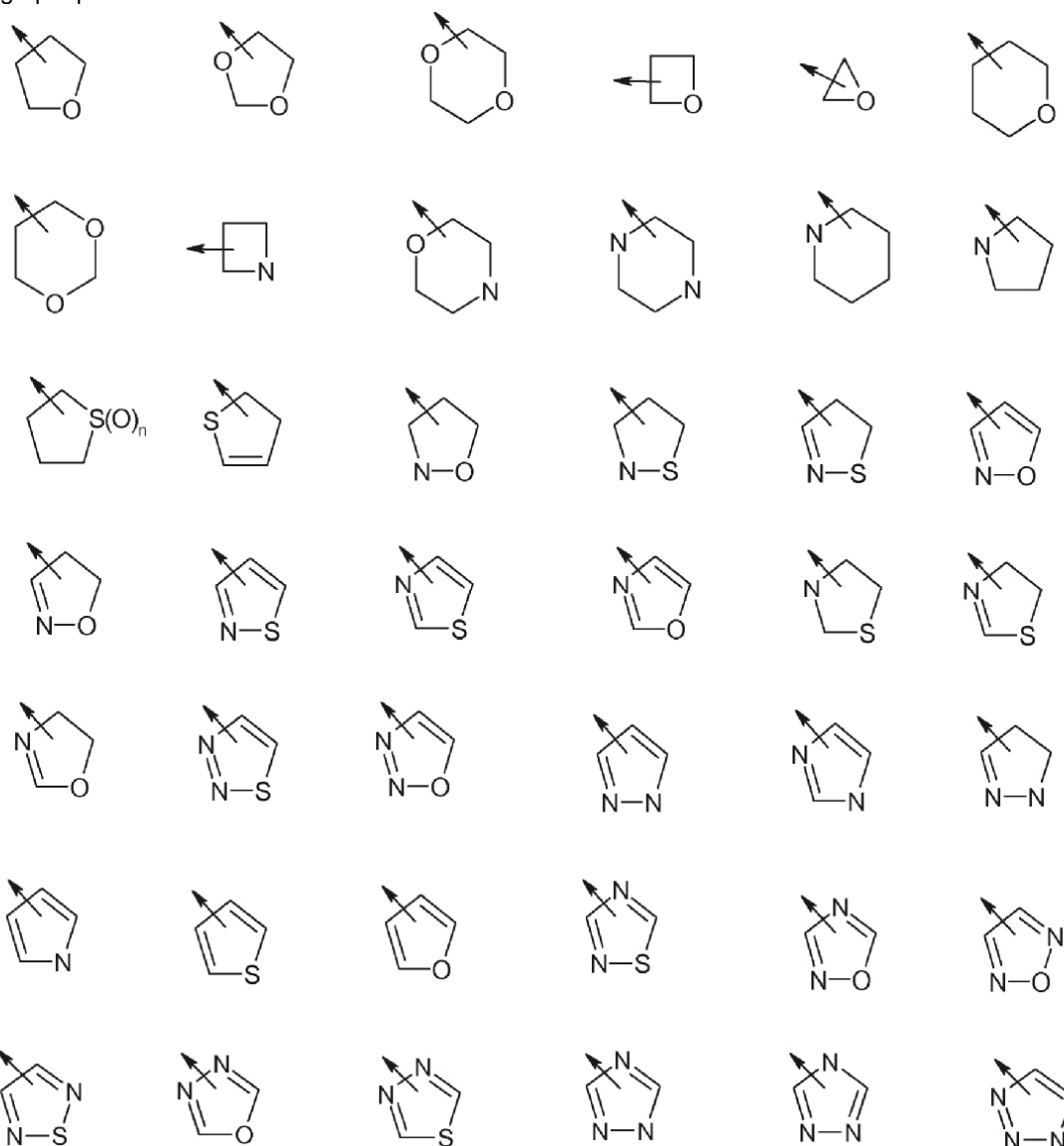
Y significa oxígeno o azufre;

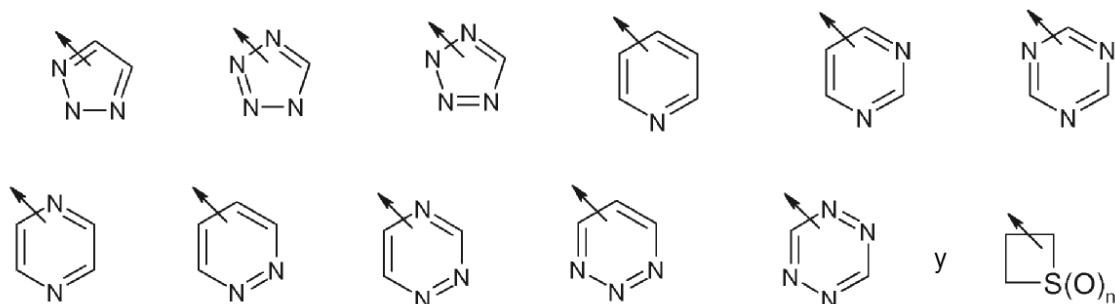
X significa hidrógeno, ciano, hidroxilo, X¹

5 o alquilo (C₁-C₁₂), cicloalquilo (C₃-C₈), alqueniolo (C₂-C₁₂) o alquiniolo (C₂-C₁₂) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, OR⁷, X¹, OX¹, NHX¹, S(O)_nR⁵, SO₂NR⁹R⁷, SO₂NCOR⁶R⁸, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, COR⁶, CONR⁸SO₂R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶COR⁸, NR⁶CONR⁸R⁸, NR⁶CO₂R⁸, NR⁶SO₂R⁸, NR⁶SO₂NR⁶R⁸, OCONR⁶R⁸, OCSNR⁶R⁸, POR⁹R⁹ y C(R⁶)=NOR⁸

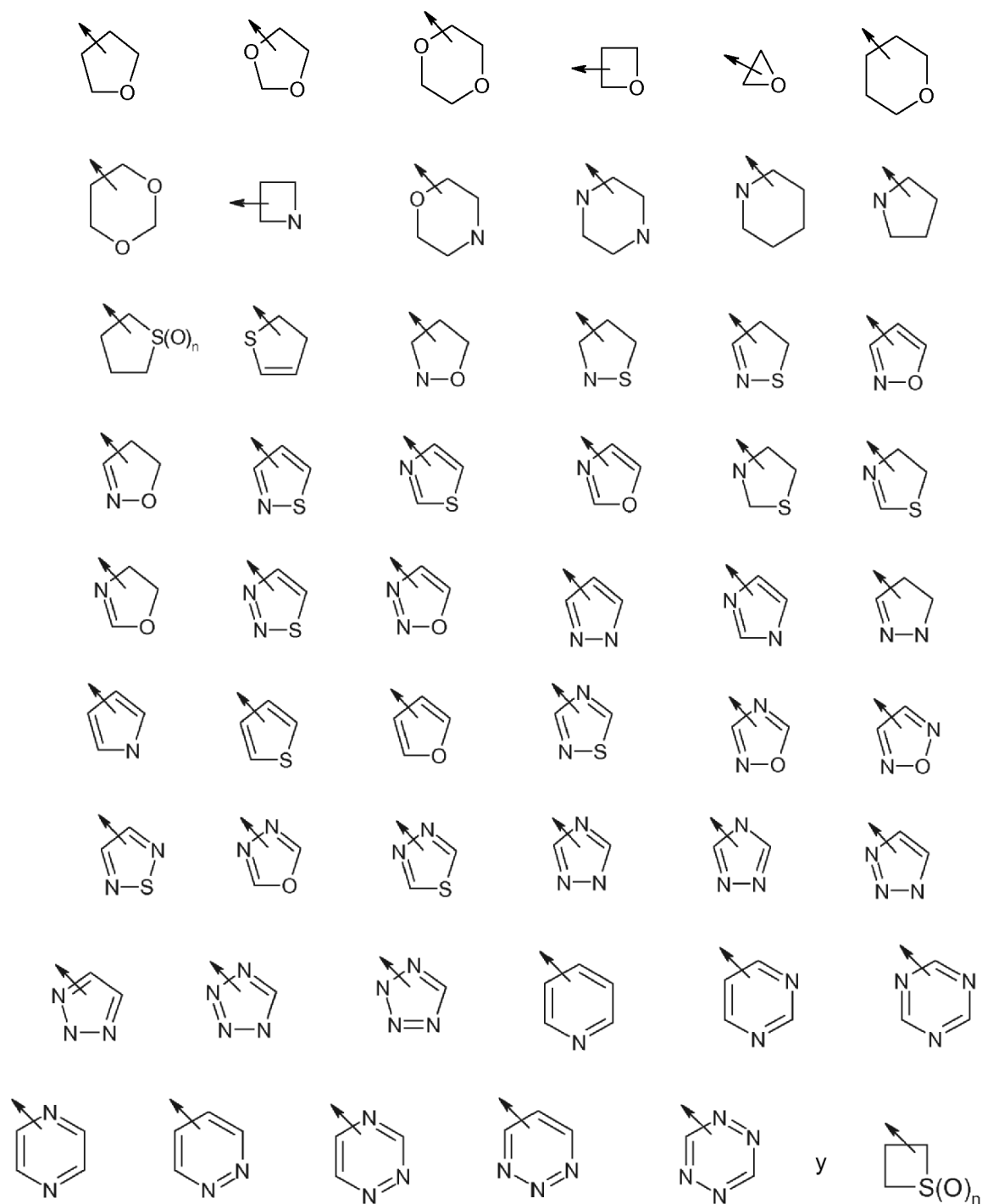
10 o X, A y R⁴ con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros saturado, parcial o totalmente insaturado que contiene, además de este átomo de nitrógeno, k átomos de carbono, n átomos de oxígeno, p átomos de azufre y p elementos del grupo que consiste en NR⁷ y NCOR⁷ como átomos del anillo, donde un átomo de carbono porta p grupos oxo;

15 X¹ significa un anillo sustituido con s restos del grupo que consiste en R⁶, R^{6a}, R⁸ y R⁹ del grupo que consiste en





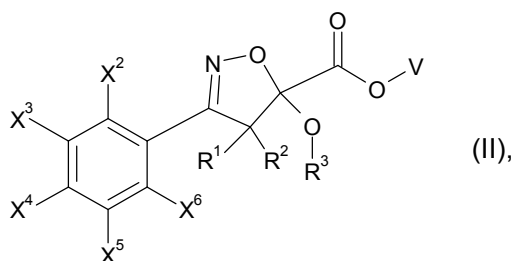
- o X^1 significa fenilo sustituido con m restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 ;
 X^2 , X^4 y X^6 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro,
 5 o alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_4), alquino (C_2-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquinoxilo (C_2-C_4),
 alquinoxilo (C_2-C_4) o alquilcarbonilo (C_1-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor,
 cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C_1-C_4);
 X^3 y X^5 significan independientemente entre sí hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, nitro, SF_5 ,
 $CONR^8SO_2R^5$, $CONR^6R^8$, COR^6 , CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, $C(R^6)=NOR^8$, NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$, $NR^6CO_2R^8$,
 10 $NR^6SO_2R^8$, $NR^6SO_2NR^6R^8$, $OCOR^6R^8$, OSO_2R^5 , $S(O)_nR^5$, $SO_2NR^6R^8$, $OSO_2NR^6R^8$,
 o alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_5), alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos
 del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo y ciano,
 o alcoxi (C_1-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_6), alquinoxilo (C_2-C_6) o alquinoxilo (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos
 del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);
 R^5 significa alquilo (C_1-C_6) o cicloalquilo (C_3-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en
 15 flúor, cloro, bromo, yodo, ciano e hidroxilo;
 R^6 significa hidrógeno o R^5 ;
 R^{6a} significa flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, $S(O)_nR^5$ o significa alcoxi (C_1-C_6), alquinoxilo (C_2-C_6) o
 alquinoxilo (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y
 alcoxi (C_1-C_2);
 R^7 significa hidrógeno o significa alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_4) o alquino (C_2-C_4)
 20 sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);
 R^8 significa R^7 ,
 R^9 significa alquilo (C_1-C_3) o alcoxi (C_1-C_3),
 k significa 3, 4, 5 o 6;
 25 m significa 0, 1, 2, 3, 4 o 5;
 n significa 0, 1 o 2;
 p significa 0 o 1;
 q significa 3, 4 o 5;
 s significa 0, 1, 2, 3 o 4.
- 30 3. 3-fenilisoaxazolin-5-carboxamidas 5-oxi-sustituidas y 3-fenilisoaxazolin-5-tioamidas 5-oxi-sustituidas de acuerdo con
 las reivindicaciones 1 o 2
 en las que
 R^1 y R^2 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o significan
 alquilo (C_1-C_4) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, yodo y ciano,
 35 R^3 significa alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_4), alqueno (C_2-C_3) o alquino (C_2-C_3) sustituidos en cada caso con m
 restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano, alcoxi (C_1-C_2),
 A significa un enlace o una unidad divalente del grupo que consiste en CH_2 , CH_2CH_2 , $CHCH_3$, $CH_2CH_2CH_2$,
 $CH(CH_2CH_3)$, $CH(CH_3)CH_2$, $C(CH_3)_2$, $C(CH_3)_2CH_2$, $C(iPr)CH_3$, $CH(CH_2iPr)CH_2$, $CH_2CH=CH$, $C(CH_3)_2C=C$,
 $CH(CF_3)CH_2$, $CH(CH_3)CH_2O$, CH_2CH_2O , $CH(cPr)CH_2O$, $CH(CH_2OCH_3)$, $CH(CH_2CH_2SCH_3)$, $CH(COOH)$,
 40 $CH(COOCH_3)$, $CH(COOH)CH_2$, $CH(COOCH_3)CH_2$, $CH_2COH(CF_3)$, $CH(CONHCH_3)$, $CH(CONHCH_3)CH_2$ y
 $CH_2CH_2CONHCH_2$;
 R^4 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_8),
 Y significa oxígeno o azufre;
 X significa hidrógeno, ciano, hidroxilo, X^1
 45 o
 alquilo (C_1-C_{12}), cicloalquilo (C_3-C_8), alqueno (C_2-C_{12}) o alquino (C_2-C_{12}) sustituidos en cada caso con m restos del
 grupo que consiste en flúor, cloro, ciano, hidroxilo, OR^7 , X^1 , OX^1 , NHX^1 , $S(O)_nR^5$, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, $CONR^8SO_2R^5$ y
 POR^9R^9 ;
 X^1 significa un anillo sustituido con s restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 del grupo que consiste en



o X^1 significa fenilo sustituido con m restos del grupo que consiste en R^6 , R^{6a} , R^8 y R^9 ;
 X^2 , X^4 y X^6 significan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, flúor o cloro,
 5 o alquilo (C_1-C_4) o alcoxi (C_1-C_4) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, ciano y alcoxi (C_1-C_4),
 X^3 y X^5 significan independientemente entre sí hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano
 o significan alquilo (C_1-C_6) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor y cloro
 o alcoxi (C_1-C_6) sustituido con m restos del grupo que consiste en flúor y cloro,
 10 R^5 significa metilo o etilo;
 R^6 significa hidrógeno o R^5 ;
 R^{6a} significa flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, $S(O)_nR^5$ o significa alcoxi (C_1-C_6), alquinoxilo (C_2-C_6) o alquinoxilo (C_2-C_6) sustituidos en cada caso con m restos del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo, ciano y alcoxi (C_1-C_2);
 15 R^7 significa hidrógeno o significa alquilo (C_1-C_6) sustituido en cada caso con m restos del grupo que consiste en

flúor y cloro,
 R^8 significa R^7 ,
 R^9 significa alcoxi (C_1-C_3),
 m significa 0, 1, 2 o 3;
 n significa 0, 1 o 2;
 s significa 0, 1, 2, 3 o 4.

- 5
4. Agentes herbicidas **caracterizados por** un contenido con actividad herbicida de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3.
5. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 4 en mezcla con coadyuvantes de formulación.
- 10
6. Agentes herbicidas de acuerdo con las reivindicaciones 4 o 5 que contienen al menos otra sustancia con actividad plaguicida del grupo de insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores del crecimiento.
7. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 6 que contienen un protector selectivo.
8. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 7 en los que el protector selectivo está seleccionado del grupo que consiste en mefenpir-dietilo, cipsosulfamida, isoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo, benoxacor y diclormid.
- 15
9. Agentes herbicidas de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 a 8 que contienen un herbicida adicional.
10. Procedimiento para combatir plantas no deseadas, **caracterizado porque** se aplica una cantidad eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 o de un agente herbicida de acuerdo con una de las reivindicaciones 4 a 9 sobre las plantas o al sitio del crecimiento vegetal no deseado.
- 20
11. Uso de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 o de agentes herbicidas de acuerdo con una de las reivindicaciones 4 a 9 para combatir plantas no deseadas.
12. Uso de acuerdo con una de las reivindicaciones 10 u 11, **caracterizado porque** los compuestos de fórmula (I) se usan para combatir plantas no deseadas en cultivos de plantas útiles.
13. Uso de acuerdo con la reivindicación 12, **caracterizado porque** las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.
- 25
14. Agentes fungicidas **caracterizados por** un contenido con actividad fungicida de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3.
15. Agentes fungicidas de acuerdo con la reivindicación 14 en mezcla con coadyuvantes de formulación.
16. Agentes fungicidas de acuerdo con las reivindicaciones 14 o 15 que contienen al menos otra sustancia con actividad plaguicida del grupo de insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores del crecimiento.
- 30
17. Compuestos de fórmula (II)



en la que

- 35
- V significa hidrógeno o R^5 y
 $X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, R^1, R^2, R^3$ y R^5 son según se define en una de las reivindicaciones 1 a 3.