

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 613 875**

51 Int. Cl.:

**C07D 309/32** (2006.01)  
**C07D 405/12** (2006.01)  
**C07D 407/12** (2006.01)  
**C07D 409/12** (2006.01)  
**C07D 413/12** (2006.01)  
**C07D 417/12** (2006.01)  
**A01N 43/16** (2006.01)  
**A01N 43/40** (2006.01)

12

## TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **27.11.2013 PCT/JP2013/082513**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **05.06.2014 WO2014084407**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **27.11.2013 E 13811627 (2)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.01.2017 EP 2925736**

54 Título: **Compuestos de dihidropirona y herbicidas que los comprenden**

30 Prioridad:

**28.11.2012 JP 2012259421**

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

**26.05.2017**

73 Titular/es:

**SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD (100.0%)  
27-1 Shinkawa 2-chome  
Chuo-ku, Tokyo 104-8260, JP**

72 Inventor/es:

**NAKASHIMA, YOSUKE y  
JIN, YOSHINOBU**

74 Agente/Representante:

**UNGRÍA LÓPEZ, Javier**

**ES 2 613 875 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

**Compuestos de dihidropirona y herbicidas que los comprenden**

5 Esta solicitud reivindica la prioridad y el beneficio de la Solicitud de Patente Japonesa Núm. 2012-259421 presentada el 28 de noviembre de 2012.

**Campo técnico**

10 La presente invención se refiere a compuestos dihidropirona y herbicidas que comprenden los mismos.

**Técnica anterior**

15 Hasta ahora, se han desarrollado algunos compuestos que son útiles como ingredientes activos en los herbicidas para el control de malas hierbas y se han encontrado algunos compuestos que tienen eficacia para el control de las malas hierbas.

Se conocen algunos compuestos de dihidropirona que tienen actividad herbicida (véanse los Documentos de Patente 1 a 3).

20

**Lista de referencias****Documento de patente**

25 Documento de Patente 1: JP 9-505294 A  
Documento de Patente 2: JP 2004-501144 A  
Documento de Patente 3: JP 2008-505063 A

30 Además, el documento WO 2008/071405 A1 describe compuestos de pirandiona mencionado por ser útiles como herbicidas. El documento EP 588 137 A1 se refiere a derivados 3-aril-pirona descritos como herbicidas. El documento WO 2008/110308 A2 describe compuestos de ciclohexanodiona sustituidos en la posición 5 para su uso como herbicidas.

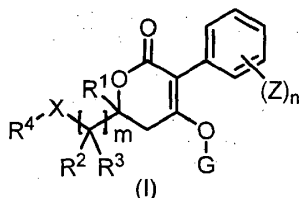
**Compendio de la invención**

35 Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto que tiene una excelente eficacia para el control de las malas hierbas.

40 Los autores de la presente invención han estudiado intensamente para encontrar esos compuestos que tienen una excelente eficacia para el control de malas hierbas y, como resultado, encontraron que un compuesto de dihidropirona de la siguiente fórmula (I) tiene una excelente eficacia para el control de malas hierbas, que de este modo han completado la presente invención.

45 Específicamente, la presente invención incluye los siguientes ítems [1] a [11].

[1] Un compuesto de dihidropirona de fórmula (I):



[en donde

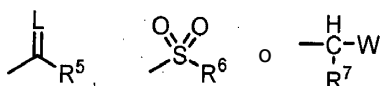
50 m es 1, 2 o 3;  
n es un número entero de cualquiera de 1 a 5;  
X representa O, S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>;  
R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;  
55 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o un grupo halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>,

alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alquileo C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se combinan entre sí para representar un grupo alquilideno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> que tiene opcionalmente uno o más átomos de halógeno (con la condición de que cuando m es 2 o 3, dos o tres R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos o tres R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

cuando X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> representa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido con un grupo metilo o un grupo etilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alquino C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquino C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxycarbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente};

cuando X representa O, R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxycarbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente};

G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



{en donde

L representa un átomo de oxígeno (O) o un átomo de azufre (S);

R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)amino, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un radical arilo del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino y un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);

R<sup>6</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen

dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> pueden tener opcionalmente uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);

R<sup>7</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

W representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí));

Z representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo heteroariloxi de cinco o seis miembros, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo heteroarilo de cinco a seis miembros, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi y el grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; cuando n es un número entero de 2 o más, Z pueden ser iguales o diferentes entre sí}} (en lo sucesivo, referido a veces como "el presente compuesto") el grupo heteroarilo en R<sup>4</sup> tiene hasta 3 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

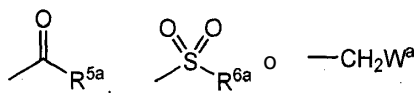
[2] El compuesto de dihidropirona del ítem [1] en donde m es 1, 2 o 3;

n es un número entero de cualquiera de 1 a 3;

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> (con la condición de que cuando m es 2 o 3, dos o tres R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos o tres R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



{en donde

R<sup>5a</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquino(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi o un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi;

R<sup>6a</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y

W<sup>a</sup> representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

Z representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo nitro, un grupo fenilo o un grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros (con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, el grupo fenilo y el grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí).

[3] El compuesto de dihidropirona del ítem [2] en donde m es 2;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de etileno (con la condición de que dos R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

G representa un átomo de hidrógeno, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butilcarbonilo, un grupo benzoilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo aliloxicarbonilo, un grupo fenoxicarbonilo, un grupo metoximetilo o un grupo etoximetilo;

R<sup>9</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo 2-nitrofenilsulfonilo o un grupo metilo;

Z representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo fenilo, un grupo vinilo, un grupo ciclopropilo, un grupo nitro, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi, un grupo trifluorometilo, un grupo 5-trifluorometil-2-cloropiridiloxi o un grupo etinilo.

[4] El compuesto de dihidropirona de uno cualquiera de los ítems [1] a [3] en donde

5 X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>; y

R<sup>4</sup> representa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido con un grupo metilo o un grupo etilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo o un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo {con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, el grupo 2-tiazolilo, el grupo 2-oxazolilo, el grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o el grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo pentafluorotio, un grupo benzoilamino y un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí.

[5] El compuesto de dihidropirona del ítem [4] en donde

20 X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>; y

R<sup>4</sup> representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2- un grupo tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo {con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, el grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4 tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un átomo de flúor, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo t-butilo, un grupo metoxi, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo acetilo, un grupo metoxicarbonilo, un grupo pentafluorotio, un grupo pentafluoroetilo, un grupo difluoroetilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo trifluorometilitio, un grupo benzoilamino, un grupo trifluorometoxi y un grupo trifluorometilo.

[6] El compuesto de dihidropirona de uno cualquiera de los ítems [1] a [3] en donde

X representa O; y

R<sup>4</sup> representa un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un 2- grupo oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo {con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, el grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, el grupo 2-tiazolilo, el grupo 2-oxazolilo, el grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o el grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo pentafluorotio, un grupo benzoilamino y un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí.

[7] El compuesto de dihidropirona del ítem [6] en donde

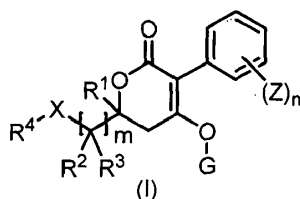
X representa O; y

45 R<sup>4</sup> representa un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un 2- grupo oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo {con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, el grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, el grupo 2-tiazolilo, el grupo 2-oxazolilo, el grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o el grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un átomo de flúor, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo t-butilo, un grupo metoxi, un nitro grupo, un grupo amino, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo acetilo, un grupo metoxicarbonilo, un grupo pentafluorotio, un grupo pentafluoroetilo, un grupo difluoroetilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo trifluorometilitio, un grupo benzoilamino, un grupo trifluorometoxi y un grupo trifluorometilo.

50 [8] El compuesto de dihidropirona de uno cualquiera de los ítems [1] a [7] en donde G representa un átomo de hidrógeno.

[9] Un herbicida que comprende un compuesto de dihidropirona de uno cualquiera de los ítems [1] a [8] como ingrediente activo y un portador inerte.

60 [10] Un método para el control de las malas hierbas, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto de dihidropirona de fórmula (I) a las malas hierbas o al suelo donde crecen las malas hierbas, en donde el compuesto de dihidropirona de fórmula (I) es un compuesto representado por una fórmula:



[en donde

m es 1, 2 o 3;

n es un número entero de cualquiera de 1 a 5;

5 X representa O, S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>;

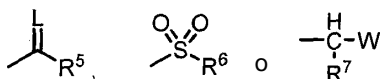
R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o un grupo halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se combinan entre sí para representar un grupo alquilideno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> que tiene opcionalmente uno o más átomos de halógeno (con la condición de que cuando m es 2 o 3, dos o tres R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos o tres R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

cuando X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> representa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido con un grupo metilo o un grupo etilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo alcoxil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquinil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente};

cuando X representa O, R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxicarbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquinil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente};

G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



50

{en donde

L representa un átomo de oxígeno (O) o un átomo de azufre (S);

R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alqueno(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquino(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alqueno(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alqueno(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un radical arilo del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino y un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);

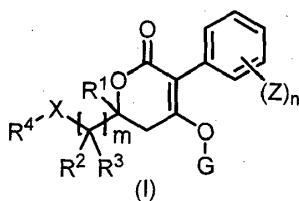
R<sup>6</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> pueden tener opcionalmente uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);

R<sup>7</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

W representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfino o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí);

Z representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo heteroariloxi de cinco o seis miembros, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo heteroarilo de cinco a seis miembros, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi y el grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; cuando n es un número entero de 2 o más, Z pueden ser iguales o diferentes entre sí].

[11] El uso de un compuesto de dihidropirona de fórmula (I) para el control de malas hierbas, en el que el compuesto de dihidropirona de fórmula (I) es un compuesto representado por una fórmula:



[en donde

m es 1, 2 o 3;

n es un número entero de cualquiera de 1 a 5;

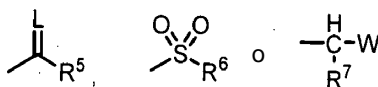
X representa O, S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>;

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o un grupo halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se combinan entre sí para representar un grupo alquilideno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> que tiene opcionalmente uno o más átomos de halógeno (con la condición de que cuando m es 2 o 3, dos o tres R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos o tres R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

cuando X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> representa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido

5 con un grupo metilo o un grupo etilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo  
 alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo  
 haloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un  
 grupo heteroarilo de cinco a seis miembros {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo  
 heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados  
 del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo  
 alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un  
 grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un  
 grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinito, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxycarbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,  
 y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el  
 grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo  
 alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo  
 aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinito, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo  
 y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos  
 haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos  
 de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente};  
 cuando X representa O, R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis  
 miembros {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros  
 pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de  
 halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo  
 alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo  
 alquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinito, un grupo  
 alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxycarbonilo, un  
 grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes,  
 los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-  
 C<sub>6</sub>, el grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el  
 grupo alquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinito, el  
 grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener  
 cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos  
 de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser  
 iguales o diferentes entre sí respectivamente};  
 G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



{en donde

40 L representa un átomo de oxígeno (O) o un átomo de azufre (S);  
 R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo  
 alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo  
 cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo  
 aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquenil(C<sub>3</sub>-  
 C<sub>6</sub>)amino, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la  
 condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen  
 dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo  
 cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo  
 cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un radical arilo  
 del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino y un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros pueden tener cada  
 uno uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo  
 pueden ser iguales o diferentes entre sí);  
 R<sup>6</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino (con  
 la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen  
 dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo  
 arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> pueden tener opcionalmente uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y cuando existen dos o más  
 grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);  
 R<sup>7</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;  
 W representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinito o un grupo



alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí));

Z representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo heteroariloxi de cinco o seis miembros, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros {con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo heteroarilo de cinco a seis miembros, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi y el grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; cuando n es un número entero de 2 o más, Z pueden ser iguales o diferentes entre sí}}.

20 El compuesto de la presente invención muestra eficacia para el control de malas hierbas y por lo tanto es útil como ingrediente activo de herbicidas.

#### Descripción de realizaciones

25 En lo sucesivo, la presente invención se explica en detalle.

Se explica el sustituyente de la presente invención.

30 El "grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo que tiene de uno a dieciocho átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un sec-butilo, un grupo neopentilo, un grupo n-hexilo, un grupo n-heptilo, un grupo n-octilo, un grupo n-nonilo, un grupo n-decilo, un grupo n-undecilo, un grupo n-dodecilo, un grupo n-tridecilo, un grupo n-tetradecilo, un grupo n-pentadecilo, un grupo n-hexadecilo, un grupo n-heptadecilo y un grupo n-octadecilo.

35 El "grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo que tiene de uno a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo terc-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo sec-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo neopentilo, un grupo n-hexilo y un grupo isohexilo.

40 El "grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquilo están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilo, un clorometilo grupo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo y un grupo 2,2,2-trifluoro-1,1-dicloroetilo.

45 El "grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquilo están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo y un grupo 2,2,2-trifluoro-1,1-dicloroetilo.

50 El "grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo cicloalquilo que tiene de tres a ocho átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo y un grupo cicloheptilo.

55 El "grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo cicloalquilo que tiene de tres a siete átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo y un grupo cicloheptilo.

60 El "grupo halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> está/están sustituidos con uno o más átomos de

halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo 2-clorociclopropilo y un grupo 4,4-difluorociclohexilo.

El "grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> están sustituidos con un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metoximetilo, un grupo 1-metoxietilo, un grupo etoximetilo, un grupo butoximetilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 1-metoxipropilo, un grupo 1-metoxibutilo, un grupo 1-metoxipentilo, un grupo 1-metoxihexilo, un grupo 1-metoxioctilo, un grupo 1-metoxidecilo y un grupo 1-metoxidodecilo.

El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> están sustituidos con un grupo alquiltio que tiene de 1 a 6 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metiltiommetilo, un grupo 1-(metiltio)etilo, un grupo etiltiommetilo, un grupo butiltiommetilo, un grupo 2-(etiltio)etilo, un grupo 1-(metiltio)pentilo, un grupo 1-(metiltio)hexilo, un grupo 1-(metiltio)octilo, un grupo 1-(metiltio)decilo y un grupo 1-(metiltio)dodecilo.

La "cadena de alquileo C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa una cadena de alquileo que tiene de dos a cinco átomos de carbono e incluye, por ejemplo, una cadena de etileno, una cadena de propileno (es decir, una cadena de trimetileno), una cadena de butileno (es decir, una cadena de tetrametileno) y una cadena pentileno (es decir, una cadena de pentametileno).

Cuando R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alquileo C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se combinan junto con el carbono al que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están anclados para formar un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Por ejemplo, cuando R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de etileno, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se combinan junto con el carbono al que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están anclados para formar un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>, es decir, un grupo ciclopropilo.

La "cadena de alquilideno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa una cadena de alquilideno que tiene de uno a tres átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metilideno, un grupo etilideno y un grupo isopropilideno.

El "átomo de halógeno" que se utiliza en la presente memoria incluye, por ejemplo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

El "grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alqueno que tiene de dos a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo alilo, un grupo 1-buten-3-ilo y un grupo 3-buten-1-ilo.

El "grupo alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alqueno que tiene de tres a dieciocho átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo 1-buten-3-ilo, un grupo 3-buten-1-ilo, un grupo pentenilo, un hexenilo grupo, un grupo octenilo, un grupo decenilo, un grupo dodecenilo, un grupo tetradecenilo, un grupo hexadecenilo y un grupo octadecenilo.

El "grupo alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alqueno que tiene de tres a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo 1-buten-3-ilo, un grupo 3-buten-1-ilo, un grupo pentenilo y un hexenilo grupo.

El "grupo haloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alqueno que tiene de tres a dieciocho átomos de carbono en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alqueno están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo 1-cloro-propen-2-ilo, un grupo 1-bromo-propen-2-ilo, un grupo 1-cloro-2-propenilo, un 1-cloro-2-hexenilo, un grupo 1-cloro-2-octenilo, un grupo 1-cloro-2-decenilo, un grupo 1-cloro-2-dodecenilo, un grupo 1-cloro-2-tetradecenilo, un grupo 1-cloro-2-hexadecenilo y un grupo 1-cloro-2-octadecenilo.

El "grupo haloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alqueno que tiene de tres a seis átomos de carbono en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alqueno están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo 1-cloro-propen-2-ilo, un grupo 1-bromo-propen 2-ilo, un grupo 1-cloro-2-pentenilo y un grupo 1-cloro-2-hexenilo.

El "grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquino que tiene de dos a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo etinilo, un grupo propargilo y un grupo 2-butinilo.

- 5 El "grupo alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquinilo que tiene de tres a dieciocho átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo propargilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 2-hexinilo, un grupo 2-octinilo, un grupo 2-decinilo, un grupo 2-dodecinilo, un grupo 2-tetradecinilo, un grupo 2-hexadecinilo y un grupo 2-octadecinilo.
- 10 El "grupo alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquinilo que tiene de tres a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo propargilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 2-pentinilo y un grupo 2-hexinilo.
- 15 El "grupo haloalquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquinilo están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo 1-cloro-2-butinilo, un grupo 1-cloro-2-pentinilo, un grupo 1-cloro-2-hexinilo, un grupo 1-cloro-2-heptinilo, un grupo 1-cloro-2-octinilo, un grupo 1-cloro-2-noninilo, un grupo 1-cloro-2-decinilo, un grupo 1-cloro-2-dodecinilo, un grupo 1-cloro-2-tetradecinilo, un grupo 1-cloro-2-hexadecinilo y un grupo 1-cloro-2-octadecinilo.
- 20 El "grupo haloalquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquinilo están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo 1-cloro-2-butinilo, un grupo 1-cloro-2-pentinilo y un grupo 1-cloro-2-hexinilo.
- 25 El "grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alcoxi que tiene de uno a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propiloxi, un grupo isopropiloxi, un grupo n-butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo terc-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo sec-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo n-hexiloxi y un grupo isohexiloxi.
- 30 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquiltio que tiene de uno a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio y un grupo isopropiltio.
- 35 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquiltio que tiene de uno a tres átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metiltio y un grupo etiltio.
- El "grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alqueniloxi que tiene de tres a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo aliloxi y un grupo 2-buteniloxi.
- 40 El "grupo alquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquiloxi que tiene de tres a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo propargiloxi y un grupo 2-buteniloxi.
- 45 El "grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> en donde un átomo de hidrógeno del grupo alcoxi está sustituido con un grupo arilo que tiene de seis a diez átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo benciloxi y un fenetiloxi.
- El "grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> en donde un átomo de hidrógeno del grupo alquilo está sustituido con un grupo arilo que tiene de seis a diez átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo bencilo y un fenetilo.
- 50 El "grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo cicloalcoxi que tiene tres a ocho átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclopentiloxi, y un grupo ciclohexiloxi.
- 55 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo amino en donde dos átomos de hidrógeno del grupo amino están sustituidos con dos grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que pueden ser iguales o diferentes entre sí e incluye, por ejemplo, un grupo dimetilamino, un grupo dietilamino y un grupo etilmetilamino.
- 60 El "grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)amino" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo amino en donde dos átomos de hidrógeno del grupo amino están sustituidos con dos grupos alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> que pueden ser iguales o diferentes entre sí e incluye, por ejemplo, un grupo dialilamino y un grupo di(3-butenil)amino.
- El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)arilo(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo amino en donde dos átomos de hidrógeno del grupo amino están sustituidos con un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> e incluye, por ejemplo, un grupo metilfenilamino y un grupo etilfenilamino.

- 5 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilsulfonilo que tiene de uno a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo y un grupo isopropilsulfonilo.
- 10 El "grupo "alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilsulfonilo que tiene de uno a seis átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo y un grupo isopropilsulfonilo.
- 15 El "grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo arilo que tiene de seis a diez átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo fenilo y un grupo naftilo.
- El "grupo heteroarilo de cinco a seis miembros" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo heterocíclico aromático de cinco o seis miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre e incluye, por ejemplo, un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-furilo, un grupo pirimidinilo, un grupo 3-tienilo y un grupo 1-pirazolilo.
- 20 El "grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo ariloxi que tiene de seis a diez átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo fenoxi y un grupo naftiloxi.
- 25 El "grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo heterocicliloxi aromático de cinco o seis miembros que tiene de uno a tres heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre e incluye, por ejemplo, un grupo 2-piridiloxi y un grupo 3-piridiloxi.
- 30 El "grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo carbonilo que tiene un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> e incluye, por ejemplo, un grupo metoxicarbonilo y un grupo etoxicarbonilo.
- El "grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo carbonilo que tiene un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> e incluye, por ejemplo, un grupo metoxicarbonilo y un grupo etoxicarbonilo.
- 35 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo amino en donde un átomo de hidrógeno del grupo amino está sustituido con un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> e incluye, por ejemplo, un grupo monometilamino y un grupo monoetilamino.
- 40 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo carbonilo que tiene un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> e incluye, por ejemplo, un grupo metilcarbonilo, un grupo etilcarbonilo, un grupo isopropilcarbonilo, un grupo butilcarbonilo, un grupo pentilcarbonilo y un grupo hexilcarbonilo.
- 45 El "grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo carbonilo que tiene un grupo alquilo que tiene de uno a tres átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metilcarbonilo, un grupo etilcarbonilo y un grupo isopropilcarbonilo.
- El "grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo que tiene de uno a tres átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo y un grupo isopropilo.
- 50 El "grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alcoxi que tiene de uno a tres átomos de carbono e incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propiloxi y un grupo isopropiloxi.
- 55 El "grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquilo están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo y un grupo 2,2,2-trifluoro-1,1-dicloroetilo.
- 60 El "grupo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> en donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alcoxi están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo 3,3-difluoropropiloxi y un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi.
- El "grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio" que se va a utilizar en la presente memoria significa un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio en

donde uno o más átomos de hidrógeno del grupo alquiltio están sustituidos con uno o más átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometiltio, un grupo clorometiltio, un grupo 2,2,2-tricloroetiltio, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio y un grupo 2,2,2-trifluoro-1,1-dicloroetiltio.

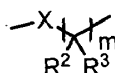
5 Para el presente compuesto, los compuestos de dihidropirona de la fórmula (I) pueden formar sales agronómicamente aceptables con bases inorgánicas o bases orgánicas y la presente invención puede abarcar las formas de sal del compuesto de dihidropirona. La sal incluye, por ejemplo, sales que se forman mezclando el compuesto con bases inorgánicas (por ejemplo, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos, acetatos o hidruros de metales alcalinos (por ejemplo, litio, sodio y potasio)), hidróxidos o hidruros de metales alcalinotérreos (por ejemplo, magnesio, calcio y bario) y amoníaco), bases orgánicas (por ejemplo, dimetilamina, trietilamina, piperazina, pirrolidina, piperidina, 2-feniletilamina, bencilamina, etanolamina, dietanolamina, piridina y colidina) o alcóxidos de metales (por ejemplo, metóxido de sodio, terc-butóxido de potasio y metóxido de magnesio).

15 Cuando el presente compuesto tiene uno o más centros asimétricos, pueden existir dos o más estereoisómeros (por ejemplo, enantiómero y diastereómero). El presente compuesto puede abarcar todos estos estereoisómeros y una mezcla arbitraria de dos o más estereoisómeros.

20 Asimismo, cuando el presente compuesto contiene isómeros geométricos debido a un doble enlace y similares, pueden existir dos o más isómeros geométricos (por ejemplo, cada isómero E/Z o trans/cis, cada isómero S-trans/S-cis y otros). El presente compuesto puede abarcar todos estos isómeros geométricos y una mezcla arbitraria de dos o más isómeros geométricos.

Como realización del presente compuesto, se incluyen los siguientes compuestos por ejemplo.

- 25 un compuesto en donde m es 2;  
 un compuesto en donde n es 3;  
 un compuesto en donde m es 2 y n es 3;  
 un compuesto en donde X es S;  
 un compuesto en donde R<sup>2</sup> es un átomo de hidrógeno;  
 un compuesto en donde R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno;  
 30 un compuesto en donde un resto representado por una fórmula:



en la fórmula (I) representa -S-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -S-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-, -S-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-, -O-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -S(O)-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -S(O)-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-, -S(O)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -S(O)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-, -S-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-, -S-CH<sub>2</sub>C(ciclopropil)-, -S-CH<sub>2</sub>CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-, -S-CH<sub>2</sub>-O-S-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-;

35 un compuesto en el que R<sup>4</sup> representa un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo;

un compuesto en el que Z es un grupo fenilo o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene opcionalmente uno o más átomos de halógeno;

40 un compuesto de dihidropirona en donde

m es 1, 2 o 3;

n es 1, 2 o 3;

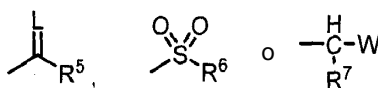
X representa O, S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>;

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno;

45 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, de forma alternativa R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alquilenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de entre seis y de cinco miembros puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener opcionalmente uno o más átomos de halógeno);

55 G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



{donde

L representa un átomo de oxígeno (O);

R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueniil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi o un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi;

R<sup>6</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>7</sup> representa un átomo de hidrógeno;

W representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

Z representa un átomo de halógeno, un grupo fenilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o un grupo heteroariloxi de seis miembros (con la condición de que el grupo fenilo y el grupo heteroariloxi de seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí).

Un compuesto de dihidropirona en donde

m es 1, 2 o 3;

n es un número entero de uno cualquiera de 1 a 3;

X representa O, S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>;

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno;

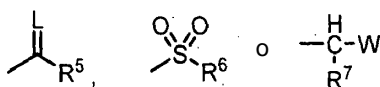
R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alternativamente

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>;

cuando X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco a seis miembros puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí); o

cuando X representa O, R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> puede tener opcionalmente uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> puede tener uno o más átomos de halógeno, y cuando hay dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí};

G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



(en donde

L representa un átomo de oxígeno (O);

R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueniil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi o un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi;

R<sup>6</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>7</sup> representa un átomo de hidrógeno;

W representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

Z representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros o un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> (con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y el grupo alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener opcionalmente uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; el grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros o el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí).

El herbicida de la presente invención comprende el presente compuesto y portadores inertes (en lo sucesivo, referido a veces como "el presente herbicida"). El presente herbicida se puede prepara habitualmente mediante la adición de más agentes auxiliares a la formulación tales como tensioactivos, agentes adherentes, dispersantes y estabilizadores para su formulación en polvos mojables, gránulos dispersables en agua, formulaciones autosuspensibles, gránulos, formulaciones autosuspensibles secas, concentrados emulsionables, soluciones acuosas, soluciones oleosas, agentes humeantes, aerosoles, microcápsulas y otros. El presente herbicida generalmente contiene el presente compuesto en 0,1 a 80% en peso.

El soporte inerte incluye un portador sólido, un portador líquido y un portador gaseoso.

5 Los ejemplos del portador sólido incluyen arcillas (por ejemplo, caolín, tierra de diatomeas, dióxido de silicio hidratado sintético, arcilla de Fubasami, bentonita y arcilla ácida), talcos o los otros minerales inorgánicos (por ejemplo, sericita, polvo de cuarzo, polvo de azufre, carbón activado, carbonato de calcio y sílice hidratada) en forma de polvos o partículas finas, y los ejemplos del portador líquido incluyen agua, alcoholes (por ejemplo, metanol y etanol), cetonas (por ejemplo, acetona y metil etil cetona), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, etilbenceno y metilnaftaleno), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, n-hexano, ciclohexano y queroseno), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo y acetato de butilo), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo y isobutironitrilo), éteres (por ejemplo, dioxano y éter diisopropílico), amidas de ácido (por ejemplo, N,N-dimetilformamida y dimetilacetamida), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, tricloroetileno y tetracloruro de carbono) y otros.

10 Los ejemplos de los tensioactivos incluyen alquilsulfatos, alquilsulfonatos, arilalquilsulfonatos, alquil aril éteres y compuestos polioxietilenados de los mismos, éteres de polietilenglicol, ésteres de polioles y derivados de alcoholes de azúcares

15 Los ejemplos de otros agentes auxiliares para formulación incluyen agentes adherentes y dispersantes, específicamente caseína, gelatina, polisacáridos (por ejemplo, almidón, goma arábica, derivados de celulosa y ácido algínico), derivados de lignina, bentonita, azúcares, polímeros sintéticos solubles en agua (por ejemplo, poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona y poli(ácidos acrílicos), PAP (fosfato ácido de isopropilo), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol), BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol), aceites vegetales, aceites minerales, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos de los mismos y otros.

20 El método para el control de malas hierbas de la presente invención comprende aplicar una cantidad eficaz del presente compuesto a las malas hierbas o a un suelo en el que crecen las malas hierbas (en lo sucesivo, a veces referido como "el presente método de control de malas hierbas"). En el método para el control de malas hierbas de la presente invención, se utiliza usualmente el presente herbicida. El método de aplicación comprende, por ejemplo, un tratamiento del follaje de las malas hierbas utilizando el presente herbicida, un tratamiento de la superficie del suelo donde crecen las malas hierbas, y un tratamiento de incorporación al suelo del suelo donde crecen las malas hierbas. En el presente método de control de malas hierbas, el presente compuesto se aplica en una cantidad de usualmente 1 a 5.000 g y preferiblemente de 10 a 1.000 g por 10.000 m<sup>2</sup> de área en la que se van a controlar las malas hierbas.

25 El presente compuesto se puede aplicar a un terreno agrícola y otros en los que se cultiva la "planta" como se menciona más abajo.

"Planta":

40 Cultivos:

maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, trigo sarraceno, remolacha, colza, girasol, caña de azúcar, tabaco, lúpulo, y otros;

45 Hortalizas:

50 hortalizas solanáceas (por ejemplo, berenjena, tomate, pimiento morrón, pimiento y patata),  
 hortalizas cucurbitáceas (por ejemplo, pepino, calabaza, calabacín, sandía y melón),  
 hortalizas crucíferas (por ejemplo, rábano japonés, nabo blanco, rábano picante, colinabo, col china, col, hojas de mostaza, brócoli y coliflor),  
 hortalizas asteráceas (por ejemplo, bardana, margarita corona, alcachofa y lechuga),  
 hortalizas liliáceas (por ejemplo, cebolla verde, cebolla, ajo y espárrago),  
 hortalizas apiáceas (por ejemplo, zanahoria, perejil, apio y chirivía),  
 hortalizas quenopodiáceas (por ejemplo, espinacas y acelgas),  
 55 hortalizas lamiáceas (por ejemplo, Perilla frutescens, menta y albahaca),  
 fresa, batata, Dioscorea japonica, colocasia y otras;

Frutas:

60 frutas de pepita (por ejemplo, manzana, pera, pera japonesa, membrillo chino y membrillo),  
 frutos carnosos con hueso (por ejemplo, melocotón, ciruela, nectarina, Prunus Mume, cereza, albaricoque y ciruela),  
 cítricos (por ejemplo, Citrus unshiu, naranja, limón, lima y pomelo),

nueces (por ejemplo, castañas, nueces, avellanas, almendras, pistachos, anacardos y nueces de macadamia),  
 frutos de tipo baya (por ejemplo, arándano, arándano agrio, mora y frambuesa),  
 uva, caqui, aceituna, ciruela japonesa, plátano, café, palma datilera, coco, palma de aceite y otros;

5

Árboles distintos de árboles frutales:

té, mora,  
 planta con flores (por ejemplo, azalea enana, camelia, hortensia, sasanqua, *Illicium anisatum*, cerezos, tulipero, mirto y olivo fragante),  
 árboles de carretera (por ejemplo, fresno, abedul, cornejo, eucalipto, *Ginkgo biloba*, lila, arce, *Quercus*, álamo, árbol de Judas, *Liquidambar formosana*, plátano, zelkova, *arborvitae* japonés, abeto, tsuga, enebro, *Pinus*, *Picea*, *Taxus cuspidado*, olmo y castaño del Japón),  
*Viburnum dulce*, *Podocarpus macrophyllus*, cedro japonés, ciprés japonés, crotón, bonetero del japon y *Photinia glabra*);

10

15

Otros:

flores (por ejemplo, rosa, clavel, crisantemo, *Eustoma*, gipsófila, gerbera, caléndula, salvia, petunia, verbena, tulipán, aster, genciana, lirio, pensamiento, ciclamen, orquídea, lirio del valle, lavanda, alhelí, col ornamental, primula, flor de pascua, gladiolo, *cattleya*, margarita, *cymbidium* y *begonia*),  
 plantas de biocombustibles (por ejemplo, *jatrofa*, cártamo, *Camelina*, pasto varilla, *Miscanthus giganteus*, *Phalaris arundinacea*, *Arundo donax*, Kenaf (*Hibiscus cannabinus*), mandioca (*Manihot esculenta*), sauce (*Salicaceae*), etc.), y  
 plantas de follaje ornamentales, y otras.

20

25

Los "cultivos" incluyen cultivos modificados genéticamente.

El presente compuesto puede ser mezclado o combinado con otros herbicidas, agentes reductores de la fitotoxicidad, reguladores de crecimiento, plaguicidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas y/o sinérgicos.

30

Los ejemplos del ingrediente activo como herbicida incluyen los siguientes:

- (1) Herbicidas de ácidos fenoxialifáticos  
 2, 4-PA, MCP, MCPB, fenotiol, mecoprop, fluroxipir, triclopir, clomeprop, naproanilida y otros;
- (2) Herbicidas de ácido benzoico 2,3,6-TBA, dicamba, clopiralid, picloram, aminopirialid, quinclorac, quinmerac y otros;
- (3) Herbicidas de urea  
 diurón, linurón, clortolurón, isoproturón, fluometurón, isourón, tebutiurón, metabenztiазurón, cumilurón, daimurón, metil-daimurón y otros;
- (4) Herbicidas de triazina  
 atrazina, ameterina, cianazina, simazina, propazina, simetrina, dimetametrina, prometrina, metribuzina, triaziflam, indaziflam y otros;
- (5) Herbicidas de bupiridinio  
 paraquat, diquat y otros;
- (6) Herbicidas de hidroxibenzonitrilo  
 bromoxinilo, ioxinilo y otros;
- (7) Herbicidas de dinitroanilina  
 pendimetalina, prodiamina, trifluralina y otros;
- (8) Herbicidas organofosforados  
 amiprofos-metilo, butamifos, bensulida, piperofós, anilofos, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, bialafos y otros;
- (9) Herbicidas de carbamato  
 dialato, trialato, EPTC, butilato, bentiocarb, esprocarb, molinato, dimepiperato, swep, clorprofam, fenmedifam, fenisofam, piributicarb, asulam y otros;
- (10) Herbicidas de amiduros de ácido  
 propanilo, propizamida, bromobutida, etobenzanida y otros;
- (11) Herbicidas de cloroacetanilidas  
 acetoclor, alaclor, butaclor, dimetenamida, propaclor, metazaclor, metolaclor, pretilaclor, tenilclor, petoxamida y otros;
- (12) Herbicidas de difenil éter  
 acifluorfen-sodio, bifenox, oxifluorfen, lactofeno, fomesafeno, clometoxinilo, aclonifeno y otros;
- (13) Herbicidas de imidas cíclicas  
 oxadiazón, cinidón-etilo, etilcarfentrazona, surfentrazona, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, piralflufenetilo,

60



oxadiargilo, pentoxazona, flutiacet-metilo, butafenacilo, benzfendizona, bencarbazona, saflufenacilo y otros;

(14) Herbicidas de pirazol

benzofenap, pirazolato, pirazoxifeno, topramezona, pirasulfotol y otros;

(15) Herbicidas de tricetona

5 isoxaflutol, benzobiciclón, sulcotriona, mesotriona, tembotriona, tefuriltriona, biciclopirona y otros;

(16) Herbicidas de ácido ariloxifenoxipropiónico

clodinafop-propargilo, cihalofopbutilo, diclofop-metilo, fenoxaprop-etilo, fluazifop-butilo, haloxifop-metilo, quizalofop-etilo, metamifop y otros;

(17) Herbicidas de triona oxima

10 aloxidim-sodio, setoxidim, butroxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, tepraloxidim, tralcoxidim, profoxidim y otros;

(18) Herbicidas de sulfonilurea

15 clorsulfurón, sulfometurón-metilo, metsulfurón-metilo, clorimurón-etilo, tribenurón-metilo, triasulfurón, bensulfurón-metilo, tifensulfurón-metilo, pirazosulfuronethilo, primisulfurón-metilo, nicosulfurón, amidosulfurón, cinosulfurón, imazosulfurón, rimsulfurón, halosulfurón-metilo, prosulfurón, etametsulfurón-metilo, triflusulfurón-metilo, flazasulfurón, ciclosulfamurón, flupirsulfurón, sulfosulfurón, azimsulfurón, etoxisulfurón, oxasulfurón, yodosulfurón-metil-sodio, foramsulfurón, mesosulfurón-metilo, trifloxisulfurón, tritosulfurón, ortosulfamurón, flucetosulfurón, propirisulfurón, metazosulfurón, iofensulfurón-sodio y otros;

(19) Herbicidas de imidazolinona

20 imazametabenz-metilo, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir y otros;

(20) Herbicidas de sulfonamida

flumetsulam, metosulam, diclosulam, florasulam, cloransulam-metilo, penoxsulam, piroxsulam y otros;

(21) Herbicidas de ácido de pirimidiniloxibenzoico

25 piritiobac-sodio, bispiribac-sódico, piriminobac-metilo, piribenzoxima, piriftalida, pirimisulfano, triafamona y otros;

(22) Otros herbicidas sistémicos

30 bentazona, bromacilo, terbacilo, clortiamida, isoxaben, dinoseb, amitrol, cinmetilina, tridifano, dalapón, diflufenzopir-sodio, ditiopir, tiazopir, flucarbazona-sodio, propoxicarbazona-sodio, mefenacet, flufenacet, fentrazamida, cafenstrol, indanofano, oxaziclomefona, benfuresato, ACN, piridato, oxidazón, norflurazón, flurtamona, diflufenican, picolinafeno, beflubutamida, clomazona, amicarbazona, pinoxadeno, piraclonilo, piroxasulfona, tienocarbazona-metilo, aminociclopiraclor, ipfencarbazona, metiozolina, fenoxasulfona y otros.

Los ejemplos del ingrediente activo como agente reductor de la fitotoxicidad incluyen los siguientes:

35 benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciometrinilo, diclormid, fenclorazol-etilo, fenclorim, flurazol, furilazol, mefenpir-dietilo, MG191, oxabetrinilo, alidoclor, isoxadifen-etilo, ciprosulfamida, fluxofenim, anhídrido 1,8-naftálico, AD-67 y otros.

Los ejemplos del ingrediente activo como regulador del crecimiento vegetal incluyen los siguientes:

40 himexazol, paclobutrazol, uniconazol-P, inabenfida, prohexadiona-calcio, aviglicina, acetamida 1-naftaleno, ácido abscísico, ácido indolbutírico, eticlozato, etefón, cloxifonac, clormecuat, diclorprop, giberelinas, prohidrojasmon, benciladenina, forclorfenurón, hidrazida maleica, peróxido de calcio, mepiquat-cloruro, 4-CPA (ácido 4 -clorofenoxiacético) y otros.

Los ejemplos de el ingrediente activo como plaguicida incluyen los siguientes:

(1) Compuestos organofosforados

50 acefato, butatofos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos (abreviatura: CYAP), diazinón, diclofentión (abreviatura: ECP), diclorvos (abreviatura: DDVP), dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, fentión (abreviatura: MPP), fenitrotión (abreviatura: MEP), fostiazato, formotión, isofenfos, isoxatión, malatión, mesulfenfos, metidation (abreviatura: DMTP), monocrotofos, naled (abreviatura: BRP), oxideprofos (abreviatura: ESP), paratión, fosalona, fosmet (abreviatura: PMP), pirimifos-metilo, piridafentión, quinalfos, fentoato (abreviatura: PAP), profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitión, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometón, triclorfón (abreviatura: DEP), vamidotión, forato, cadusafofos y otros;

(2) Compuestos de carbamato

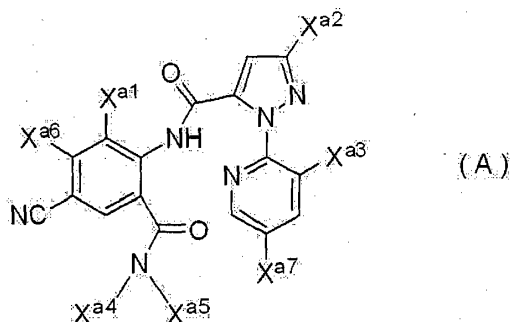
60 alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbarilo, carbofurano, carbosulfán, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocab (abreviatura: MIPC), metolcarb, metomilo, metiocarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur (abreviatura: APS), XMC, tiodicarb, xililcarb, aldicarb y otros;

(3) Compuestos piretroides

acrinatrina, aletrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, empenetrina,

- deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, tetrametrina, fenotrina, cifenotrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, furametrina, tau-fluvalinato, metoflutrina, proflutrina, dimeflutrina, 2,2-dimetil-3-(2-ciano-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, 2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, protrifenbute y otros;
- (4) Compuestos de Nereistoxinas  
cartap, bensultap, tiociclám, monosultap, bisultap;
- (5) Compuestos neonicotinoides y otros;
- (6) Compuestos de benzoilurea  
clorfluazurón, bistriflurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón y otros;
- (7) Compuestos de fenilpirazol  
acetoprol, etiprol, fipronil, vaniliprol, piriprol, pirafluprol y otros;
- (8) Toxinas Bt  
esporas vivas y toxinas de cristal originadas a partir de Bacillus thuringiensis y una mezcla de los mismos;
- (9) Compuestos de hidrazina  
cromafenzida, halofenzida, metoxifenzida, tebufenzida y otros;
- (10) Compuestos organoclorados  
aldrina, dieldrina, clordano, DDT, dienoclor, endosulfán, metoxicloro y otros; y
- (11) Otros ingredientes activos de plaguicidas  
aceite de máquina, nicotina-sulfato; avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciromazina, DCIP (éter diclorodiisopropílico), D-D (1,3-dicloropropeno), emamectina-benzoato, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, metopreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetrozina, piridililo, piriproxifeno, espinosad, sulfluramida, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, lepimectina, fosforo de aluminio, óxido arsenioso, benclotiaz, cianamida cálcica, polisulfuro de calcio, DSP, flonicamid, flurimfen, formetanato, fosforo de hidrógeno, metam-amonio, metam-sodio, bromuro de metilo, potasio oleato, espiromesifeno, sulfoxaflor, azufre, metaflumizona, espirotretamato, pirifluquinazona, espinetoram, clorantraniliprol, tralopiril, diafenturiurón y otros.

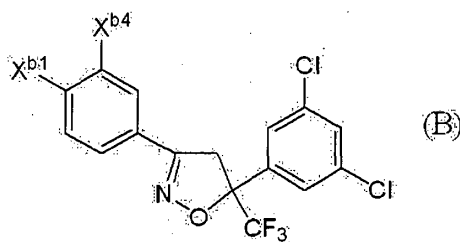
Un compuesto de fórmula (A):



en donde

- $x^{a1}$  representa un grupo metilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de flúor,  $X^{a2}$  representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo haloalquilo  $C_1-C_4$  o un grupo haloalcoxi  $C_1-C_4$ ,  $X^{a3}$  representa un átomo de flúor, un átomo de cloro o un átomo de bromo,  $X^{a4}$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido, un grupo alquenilo  $C_3-C_4$  opcionalmente sustituido, un grupo alquinilo  $C_3-C_4$  opcionalmente sustituido, un grupo cicloalquilalquilo  $C_3-C_5$  opcionalmente sustituido o un átomo de hidrógeno,  $X^{a5}$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo,  $X^{a6}$  representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro, y  $X^{a7}$  representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro.

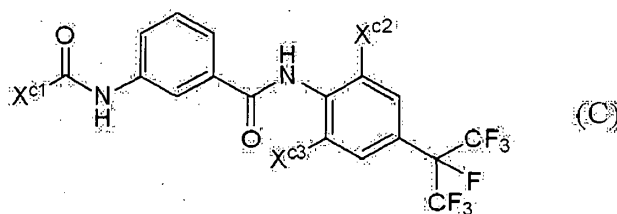
Un compuesto de fórmula (B):



en donde

$X^{b1}$  representa un grupo  $X^{b2}$ -NH-C(=O), un grupo  $X^{b2}$ -C(=O)-NH-CH<sub>2</sub>, un grupo  $X^{b3}$ -S(O), un grupo pirrol-1-ilo opcionalmente sustituido, un grupo imidazol-1-ilo opcionalmente sustituido, un grupo pirazol-1-ilo opcionalmente sustituido o un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo opcionalmente sustituido,  $X^{b2}$  representa un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido tal como un grupo 2,2,2-trifluoroetilo o un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> opcionalmente sustituido tal como un grupo ciclopropilo,  $X^{b3}$  representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido tal como un grupo metilo, y  $X^{b4}$  representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo ciano o un grupo metilo.

10 Un compuesto de fórmula (C):



en donde

15  $X^{c1}$  representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido tal como un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido tal como un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo fenilo opcionalmente sustituido tal como un grupo 4-cianofenilo o un grupo piridilo opcionalmente sustituido tal como un grupo 2-cloro-3-piridilo,  $X^{c2}$  representa un grupo metilo o un grupo trifluorometilto, y  $X^{c3}$  representa un grupo metilo o un átomo de halógeno.

20 Los ejemplos del ingrediente activo como miticida incluyen los siguientes:

acequinocilo, amitraz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, clorobenzilato, CPCBS (clorfensón), clofentezina, ciflumetofeno, Kelthane (que también es referido como dicofol), etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacipirim, halfenprox, hexitiazox, propargita (abrev: BPPS), polinactinas, piridabeno, pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifon, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato, amidoflumet, cienopirafeno y otros.

Los ejemplos del ingrediente activo como nematocida incluyen los siguientes:

DCIP, fostiazato, levamisol, metilisotiocianato, tartarato de morantel, imiciafos y otros.

30 Los ejemplos del ingrediente activo como fungicida incluyen los siguientes:

- (1) Compuestos de polihaloalquiltio captán, folpet y otros;
- (2) Compuestos organosfosforados IBP, EDDP, tolclofos-metilo y otros;
- (3) Compuestos de benzimidazol benomilo, carbendazima, tiofanato-metilo, tiabendazol y otros;
- (4) Compuestos de carboxiamida carboxina, mepronilo, flutolanilo, tifluzamida, furametpir, boscalida, pentiopirad y otros;
- (5) Compuestos de dicarboxiimida procimidona, iprodiona, vinclozolina y otros;
- (6) Compuestos de acilalanina metalaxilo y otros;
- (7) Compuestos de azol triadimefón, triadimenol, propiconazol, tebuconazol, ciproconazol, epoxiconazol, protioconazol, ipconazol, triflumizol, procloraz, penconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, difenoconazol, metconazol, tetraconazol, miclobutanilo, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol, imazalilo,

flutriafol y otros;

(8) Compuestos de morfolina

dodemorf, tridemorf, fenpropimorf y otros;

(9) Compuestos de estrobilurina

5 azoxistrobina, cresoxima-metilo, metominostrobin, trifloxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, fluoxastrobina, dimoxiestrobina y otros;

(10) Antibióticos

validamicina A, blastidina S, kasugamicina, polioxina y otros;

(11) Compuestos ditiocarbamato

10 mancozeb, maneb, tiuram y otros; y

(12) Otros ingredientes activos fungicidas

15 ftalida, probenazol, isoprothiolano, tricicazol, piroquilona, ferimzona, acibenzolar S-metilo, carpropamida, diclocimet, fenoxanilo, tiadinilo, diclomezina, teclotalam, pencicurón, ácido oxolínico, TPN, triforina, fenpropidina, espiroxamina, fluazinam, iminocadina, fenpiclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno, fenhexamida, siltiofam, proquinazid, ciflufenamida, caldo bordelés, diclofluanida, ciprodinilo, pirimetanilo, mepanipirim, dietofencarb, piribencarb, famoxadona, fenamidona, zoxamida, etaboxam, amisulbrom, iprovalicarb, bentiavalicarb, ciazofamida, mandipropamida, metrafenona, fluopiram, bixafeno y otros.

20 Los ejemplos del ingrediente activo como sinérgico incluyen los siguientes:

butóxido de piperonilo, sesamex, sulfóxido, N-(2-etilhexil)-8,9,10-trinorborn-5-eno-2,3-dicarboximida (MGK 264), N-decilmidazol), antirresistente - WARF, TBPT, TPP, IBP, PSCP, yoduro de metilo (CH<sub>3</sub>I), t-fenilbutenona, maleato de dietilo, DMC, FDMC, ETP, ETN y otros.

25 Los ejemplos de los sujetos que se van a controlar con el presente herbicida incluyen los siguientes:

Malas hierbas:

30 *Digitaria ciliaris*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, *Setaria glauca*, *Echinochloa crus-galli*, *Panicum dichotomiflorum*, *Panicum texanum*, *Brachiaria platyphylla*, *Brachiaria plantaginea*, *Brachiaria decumbens*, *Sorghum halepense*, *Andropogon sorghum*, *Cynodon dactylon*, *Avena fatua*, *Lolium multiflorum*, *Alopecurus myosuroides*, *Bromus tectorum*, *Bromus sterilis*, *Phalaris minor*, *Apera spica-venti*, *Poa annua*, *Agropyron repens*, *Cyperus iria*, *Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*, *Portulaca oleracea*, *Amaranthus retroflexus*, *Amaranthus hybridus*, *Amaranthus palmeri*, *Amaranthus rudis*, *Abutilon theophrasti*, *Sida spinosa*, *Fallopia convolvulus*, *Polygonum scabrum*, *Persicaria pennsylvanica*, *Persicaria vulgaris*, *Rumex crispus*, *Rumex obtusifolius*, *Fallopia japonica*, *Chenopodium album*, *Kochia scoparia*, *Polygonum longisetum*, *Solanum nigrum*, *Datura stramonium*, *Ipomoea purpurea*, *Ipomoea hederacea*, *Ipomoea hederacea*. var. *integriuscula*, *Ipomoea lacunosa*, *Convolvulus arvensis*, *Lamium purpureum*, *Lamium amplexicaule*, *Xanthium pensylvanicum*, *Helianthus annuus*, *Matricaria perforata* o *inodora*, *Matricaria chamomilla*, *Chrysanthemum segetum*, *Matricaria matricarioides*, *Ambrosia artemisiifolia*, *Ambrosia trifida*, *Erigeron canadensis*, *Artemisia princeps*, *Solidago altissima*, *Conyza bonariensis*, *Sesbania exaltata*, *Cassia obtusifolia*, *Desmodium tortuosum*, *Trifolium repens*, *Pueraria lobata*, *Vicia angustifolia*, *Commelina communis*, *Commelina benghalensis*, *Galium aparine*, *Stellaria media*, *Raphanus raphanistrum*, *Sinapis arvensis*, *Capsella bursa-pastoris*, *Veronica persica*, *Veronica hederifolia*, *Viola arvensis*, *Viola tricolor*, *Papaver rhoeas*, *Myosotis scorpioides*, *Asclepias syriaca*, *Euphorbia helioscopia*, *Chamaesyce nutans*, *Geranium carolinianum*, *Erodium cicutarium*, *Equisetum arvense*, *Leersia japonica*, *Echinochloa oryzicola*, *Echinochloa crus-galli* var. *formosensis*, *Leptochloa chinensis*, *Cyperus difformis*, *Fimbristylis miliacea*, *Eleocharis acicularis*, *Scirpus juncooides*, *Scirpus wallichii*, *Cyperus serotinus*, *Eleocharis kuroguwai*, *Bolboschoenus koshevnikovii*, *Schoenoplectus nipponicus*, *Monochoria vaginalis*, *Lindernia procumbens*, *Dopatrium junceum*, *Rotala indica*, *Ammannia multiflora*, *Elatine triandra*, *Ludwigia epilobioides*, *Sagittaria pygmaea*, *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria trifolia*, *Potamogeton distinctus*, *Oenanthe javanica*, *Callitriche palustris*, *Lindernia micrantha*, *Lindernia dubia*, *Eclipta prostrata*, *Murdannia keisak*, *Paspalum distichum*, *Leersia oryzoides* y otros;

55 Plantas acuáticas:

60 *Alternanthera philoxeroides*, *Limnobium spongia*, *Ceratopteris* (*Salvinia* sp.), *Pistia stratiotes*, *Hydrotyle verticillata* (*Hydrocotyle* sp.), algas filamentosas (*Pithophora* sp., *Cladophora* sp.), *Ceratophyllum demersum*, lenteja de agua (*Lemna* sp.), *Cabomba caroliniana*, *Hydrilla verticillata*, *Najas guadalupensis*, espigas de agua (*Potamogeton crispus*, *Potamogeton illinoensis*, *Potamogeton pectinatus* y similares), lentejas de agua (*Wolffia* sp.), milenrama acuáticas (*Myriophyllum spicatum*, *Myriophyllum heterophyllum* y similares), *Eichhornia crassipes* y otros;

Musgos, Hepáticas, Hornabeques;

*Cyanobacterium*;

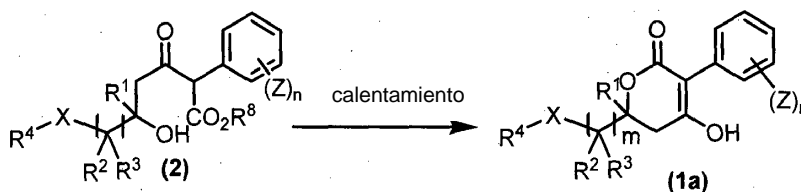
Helechos;

Retoños de plantas perennes (tales como frutas pomáceas, frutos carnosos con hueso, frutos de tipo baya, nueces, cítricos, lúpulo y uva).

El presente compuesto se puede preparar, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mencionado a continuación.

Procedimiento 1

El presente compuesto de fórmula (1a) en donde G representa un átomo de hidrógeno se puede preparar calentando un compuesto de fórmula (2) en presencia o ausencia de una base.



[en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X, n, m y Z son los mismos que se han definido anteriormente; R<sup>8</sup> representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo isopropilo, preferiblemente un grupo isopropilo]

La reacción se lleva a cabo usualmente sin disolvente, y también se puede llevar a cabo en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y mezclas disolventes de los mismos, y preferiblemente incluyen tolueno y xileno.

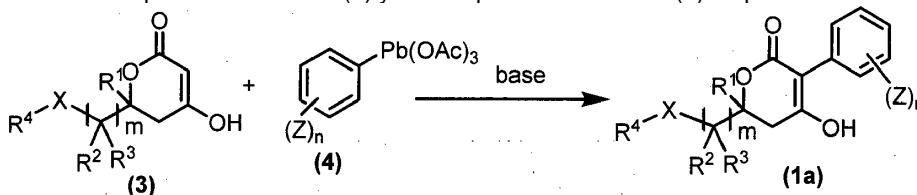
Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno. La cantidad utilizada de la base empleada en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro de un intervalo de 2 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (2).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 100 a 200°C y preferiblemente dentro del intervalo de 130 a 180°C. El período de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alta resolución. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se acidulan con un ácido, se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, mediante secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (1a).

Procedimiento 2

El presente compuesto de fórmula (1a) en donde G representa un átomo de hidrógeno se puede preparar también haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (3) y un compuesto de fórmula (4) en presencia de una base.



[en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X, n, m y Z son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

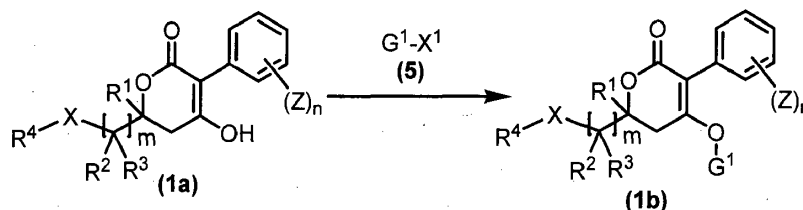
Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno. La cantidad utilizada de la base empleada en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 2 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (3).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -60 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -10 a 100°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

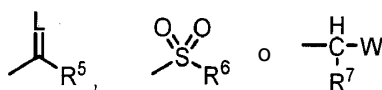
La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se acidulan con un ácido, se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de la fórmula (1a).

### Procedimiento 3

El presente compuesto de fórmula (1b) en donde el grupo G representa un grupo distinto de un átomo de hidrógeno se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula (1a) y un compuesto de fórmula (5).



[en donde G<sup>1</sup> representa un grupo de cualquiera de las fórmulas:



(en donde L, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y W son los mismos que se han definido anteriormente); X<sup>1</sup> representa un átomo de halógeno (por ejemplo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo y similares), un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)sulfoniloxi opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno (por ejemplo, un grupo metilsulfoniloxi, un grupo trifluorometilsulfoniloxi) o un grupo de una fórmula: OG<sup>1</sup> (con la condición de que cuando G<sup>1</sup> representa un grupo de fórmula:



X<sup>1</sup> representa un átomo de halógeno o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)sulfoniloxi opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno); y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X, n, m y Z son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

Los ejemplos del compuesto de fórmula (5) que se va a utilizar en la reacción incluyen haluros carboxílicos tales como cloruro de acetilo, cloruro de propionilo, cloruro de isobutirilo, cloruro de pivaloilo, cloruro de benzoilo y cloruro de ácido ciclohexanocarboxílico; anhídridos de ácidos carboxílicos tales como anhídrido acético y anhídrido trifluoroacético; haluros de hemiésteres carbonato tales como cloroformiato de metilo, cloroformiato de etilo y cloroformiato de fenilo; haluros de ácidos carbámicos tales como cloruro de dimetilcarbamoilo; haluros de ácidos sulfónicos tales como cloruro de metanosulfonilo y cloruro de p-toluenosulfonilo; anhídridos sulfónicos tales como anhídrido metanosulfónico y anhídrido trifluorometanosulfónico; éteres de alquil halogenoalquilo tales como éter clorometil metílico y éter clorometil etílico.

La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (5) utilizado en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (1a).

La reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de una base. Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno; y bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de calcio e hidruro de sodio. La cantidad usada de la base se encuentra usualmente dentro del intervalo de 0,5 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (1a).

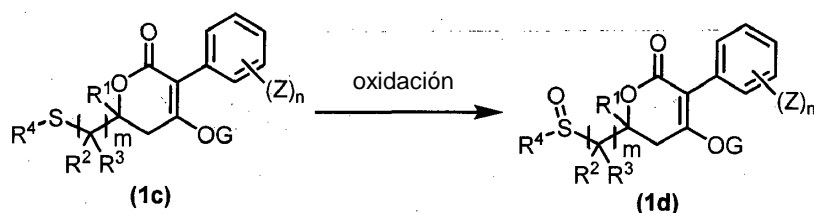
La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -30 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -10 a 50°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (1b).

El compuesto de fórmula (5) es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido.

#### Procedimiento 4

El presente compuesto en donde X representa S(O) se puede preparar mediante oxidación de un compuesto en donde X representa S, es decir, un compuesto de fórmula (1c). Cuando está contenido un grupo alquilitio o un grupo alquilsulfonilo en cualquier posición que no sea X en un compuesto de una fórmula (1c), estos grupos también se pueden oxidar.



[en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, G, n, m y Z son los mismos que se han definido anteriormente]

En la reacción se utiliza un agente oxidante. Los ejemplos del agente oxidante que se va a utilizar en la reacción incluyen peróxido de hidrógeno; perácidos tales como ácido peracético, ácido perbenzoico y ácido m-cloroperbenzoico; peryodato de sodio, ozono, dióxido de selenio, ácido crómico, tetróxido de dinitrógeno, nitrato de acetilo, yodo, bromo, N-bromosuccinimida y yodosilbenzeno. El agente oxidante se utiliza generalmente dentro del intervalo de 0,8 a 1,2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (1c).

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos saturados tales como hexano, heptano, octano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, clorobenceno y diclorobenceno; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano y tetracloruro de carbono; alcoholes tales como metanol, etanol y propanol; nitrilos tales como acetonitrilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; ácidos orgánicos tales como ácido acético y ácido propiónico; agua; y mezclas disolventes de los

mismos.

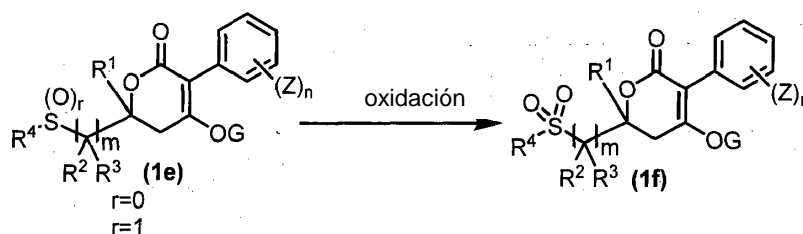
La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -50 a 100°C y preferiblemente dentro del intervalo de 0 a 50°C.

El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 10 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (1d).

#### Procedimiento 5

El presente compuesto en donde X representa S(O)<sub>2</sub> se pueden preparar mediante oxidación de un compuesto de fórmula (1e) en donde X representa S o S(O). Cuando está/están contenidos un grupo alquiltio, un grupo alquilsulfinilo, un grupo haloalquiltio y/o un grupo haloalquilsulfinilo en cualquier posición que no sea X en el compuesto de fórmula (1e), también se pueden oxidar estos grupos.



[en donde r es 0 o 1, y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, G, n, m y Z son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos saturados tales como hexano, heptano, octano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, clorobenceno y diclorobenceno; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano y tetracloruro de carbono; alcoholes tales como metanol, etanol y propanol; nitrilos tales como acetonitrilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; ácidos orgánicos tales como ácido acético y ácido propiónico; agua; y mezclas disolventes de los mismos.

En la reacción se utiliza un agente oxidante. Los ejemplos del agente oxidante incluyen peróxido de hidrógeno; perácidos tales como ácido peracético, ácido perbenzoico y ácido m-cloroperbenzoico; metaperyodato de sodio, ozono, dióxido de selenio, ácido crómico, tetróxido de dinitrógeno, nitrato de acetilo, yodo, bromo, N-bromosuccinimida, yodosilbenceno, una combinación de peróxido de hidrógeno y catalizador de tungsteno, una combinación de peróxido de hidrógeno y catalizador de vanadio, y permanganato de potasio.

Cuando se utiliza el compuesto de fórmula (1e) en donde r es 0, la cantidad utilizada del agente oxidante se encuentra usualmente dentro del intervalo de 2 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 2 a 4 equivalentes molares frente a 1 mol del compuesto de fórmula (1e). Además, cuando se utiliza el compuesto de fórmula (1e) en donde r es 1, la cantidad utilizada del agente oxidante se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en lugar de 1 mol del compuesto de fórmula (1e).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 0 a 200°C y preferiblemente de 20 a 150°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 30 minutos a 10 horas.

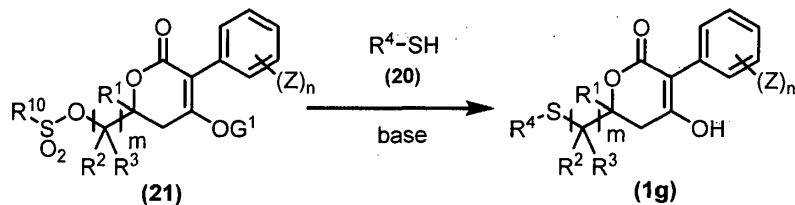
La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (1f).



## Procedimiento 6

El presente compuesto de fórmula (1 g) se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula (21) y un compuesto de fórmula (20) en presencia de una base.

5



[en donde

- 10  $R^{10}$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_6$  o un grupo arilo  $C_6-C_{10}$  (con la condición de que el grupo alquilo  $C_1-C_6$  y el grupo arilo  $C_6-C_{10}$  pueden tener opcionalmente uno o más átomos de halógeno, y cuando hay dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo  $C_6-C_{10}$  puede tener opcionalmente uno o más grupos alquilo  $C_1-C_6$ , y cuando existen dos o más grupos alquilo  $C_1-C_6$ , los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí; y
- 15  $R^1, R^2, R^3, R^4, N, m, Z$  y  $G^1$  son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y mezclas disolventes de los mismos. La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (20) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (21).

- 25 Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno. La cantidad utilizada de la base se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 2 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (21).

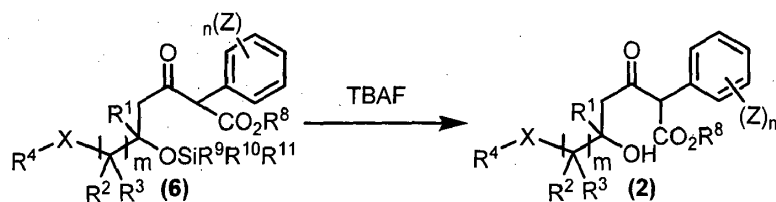
- 30 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de  $-60$  a  $180^\circ\text{C}$  y preferiblemente dentro del intervalo de  $-10$  a  $100^\circ\text{C}$ . El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

- 35 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, se añade un ácido a las mezclas de reacción, y las mezclas de reacción se mezclan a continuación con agua y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (1 g).

- 40 Los compuestos que se preparan de acuerdo con los procedimientos 1 a 5 antes mencionados se pueden aislar y/o purificar mediante otros métodos conocidos tales como concentración, concentración a presión reducida, extracción, re-extracción, cristalización, recristalización y cromatografía.

## Procedimiento de Referencia 1

- 45 El presente compuesto de fórmula (2) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (6) y fluoruro de tetrabutilamonio (en lo sucesivo, a veces descrito como "TBAF") en presencia de una base.



50

[en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, X, Z, n y m son los mismos que se han definido anteriormente; R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo t-butilo, un grupo isopropilo o un grupo fenilo, preferiblemente un grupo metilo]

5 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente en una atmósfera de gas inerte. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

10 Los ejemplos del gas inerte que se va a utilizar en la reacción incluyen el nitrógeno y el argón.

La cantidad utilizada de fluoruro de tetrabutilamonio empleado en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (6).

15 Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen amiduros de metales alcalinos, tales como diisopropilamido de litio, y bis(trimetilsilil)amido de sodio, bis(trimetilsilil)amido de litio y bis(trimetilsilil)amido de potasio; bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno y N,N-diisopropiletilamina; alcóxidos metálicos tales como terc-butóxido potásico; e hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, y amiduros de metales alcalinos tales como preferiblemente diisopropilamido de litio.

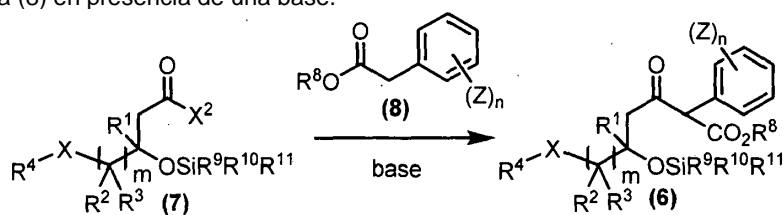
20 La cantidad utilizada de la base empleada en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (6).

25 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C, preferiblemente dentro del intervalo de -80 a 50°C y más preferiblemente dentro de un intervalo de -20 a 40°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

30 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (2).

#### Procedimiento de Referencia 2

40 El compuesto de fórmula (6) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (7) y el compuesto de fórmula (8) en presencia de una base.



45 [en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, Z, X, n y m son los mismos que se han definido anteriormente; Además, X<sup>2</sup> representa un átomo de halógeno (por ejemplo, átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo)]

50 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; y mezclas disolventes de los mismos.

55 La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (8) que se utiliza en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (7).

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen amiduros de metales alcalinos, tales como

diisopropilamido de litio, bis(trimetilsilil)amido de sodio, bis(trimetilsilil)amido de litio y bis(trimetilsilil)amido de potasio.

5 La cantidad utilizada de la base que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (8).

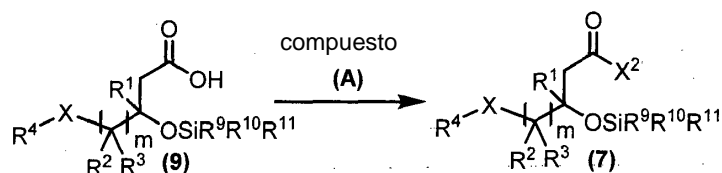
10 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -80 a 30°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

15 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (6).

El compuesto de fórmula (8) es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido.

20 Procedimiento Referencia 3

El compuesto de fórmula (7) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (9) y el compuesto (A).



25 [en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, X, X<sup>2</sup> y m son los mismos que se han definido anteriormente]

30 Los ejemplos del compuesto (A) que se va a utilizar en la reacción incluyen cloruro de tionilo, tribromuro de fósforo, trioduro de fósforo y 1-cloro-2-metil-1-propenil dimetil amina. Un ejemplo preferible incluye 1-cloro-2-metil-1-propenil dimetil amina.

35 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos. Un ejemplo preferible incluye hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano.

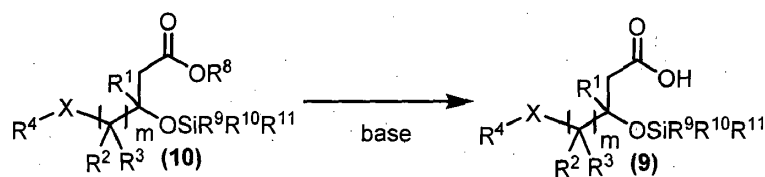
40 La cantidad utilizada del compuesto (A) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (9).

45 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -30 a 150°C y preferiblemente dentro del intervalo de -10 a 30°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

50 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la concentración de las mezclas de reacción a presión reducida y la realización de métodos analíticos tales como instrumento de resonancia magnética nuclear en los materiales orgánicos resultantes. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las soluciones de reacción son tratados (por ejemplo, concentración a presión reducida) para obtener el compuesto de fórmula (7).

Procedimiento de Referencia 4

55 El compuesto de fórmula (9) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (10) y una base.



[en donde,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$ , X y m son los mismos que se han definido anteriormente]

5 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; alcoholes tales como metanol y etanol; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y mezclas disolventes de los mismos.

10 Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio.

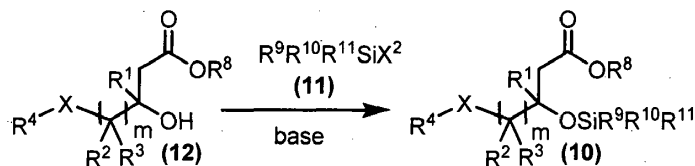
La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (10).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de  $-60$  a  $180^\circ\text{C}$  y preferiblemente dentro del intervalo de  $-10$  a  $100^\circ\text{C}$ . El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción por medio de cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento y similares. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, a las mezclas de reacción se les añade un ácido y la mezcla de reacción resultante se mezcla con agua, y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica resultante se trata (por ejemplo, secado y concentración) a obtener el compuesto de fórmula (9).

#### Procedimiento de Referencia 5

El compuesto de fórmula (10) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (12) y un compuesto de fórmula (11) en presencia de una base.



[en donde,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$ , X,  $X^2$  y m son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

Los ejemplos del compuesto de fórmula (11) que se va a utilizar en la reacción incluyen clorotrimetilsilano y terc-butildimetilclorosilano.

La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (11) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (12).

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen amiduros de metales alcalinos, tales como diisopropilamiduro de litio, bis(trimetilsilil)amiduro de sodio, bis(trimetilsilil)amiduro de litio y bis(trimetilsilil)amiduro de potasio; bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno, N,N-diisopropiletamina e imidazol; alcóxidos metálicos tales como terc-butóxido de potasio; e hidruros

de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, y bases orgánicas tales como preferiblemente imidazol.

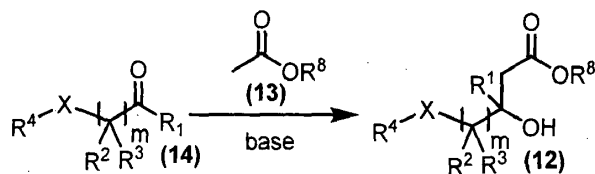
La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (12).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -10 a 100°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (10).

Procedimiento de referencia 6

El compuesto de fórmula (12) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (13) y una base, seguido de la reacción con un compuesto de fórmula (14).



[en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, X y m son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

Los ejemplos del compuesto de fórmula (13) que se va a utilizar en la reacción incluyen acetato de metilo, acetato de etilo y acetato de isopropilo.

La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (13) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (14).

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen amiduros de metales alcalinos, tales como diisopropilamiduro de litio, bis(trimetilsilil)amiduro de sodio, bis(trimetilsilil)amiduro de litio y bis(trimetilsilil)amiduro de potasio; bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno y N,N-diisopropiletilamina; alcóxidos metálicos tales como terc-butóxido de potasio; e hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, y amiduros de metales alcalinos tales como preferiblemente diisopropilamiduro de litio.

La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (13).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -80 a 50°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

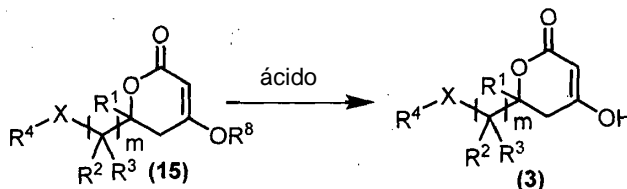
La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y

concentración) para obtener el compuesto de fórmula (12).

El compuesto de fórmula (13) es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido.

5 Procedimiento de Referencia 7

El compuesto de fórmula (3) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (15) en presencia de un ácido.



10 [en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, X y m son los mismos que se han definido anteriormente]

15 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; alcoholes tales como metanol y etanol; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y mezclas disolventes de los mismos.

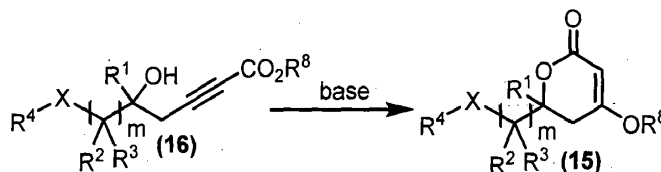
20 Los ejemplos del ácido que se va a utilizar en la reacción incluyen ácido clorhídrico y tribromuro de boro. La cantidad utilizada del ácido que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares frente a 1 mol del compuesto de fórmula (15).

25 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -80 a 50°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

30 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, se añade un ácido a la mezcla de reacción y la mezcla de reacción resultante se mezcla con agua, y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica resultante se trata (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (3).

Procedimiento de Referencia 8

35 El compuesto de fórmula (15) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (16) en presencia de una base.



[en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, X y m son los mismos que se han definido anteriormente]

40 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; alcoholes tales como metanol y etanol; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y mezclas disolventes de los mismos, y preferiblemente alcoholes tales como metanol y etanol.

45 Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen alcóxidos metálicos tales como metóxido de sodio.

La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares frente a 1 mol del compuesto de fórmula (16).

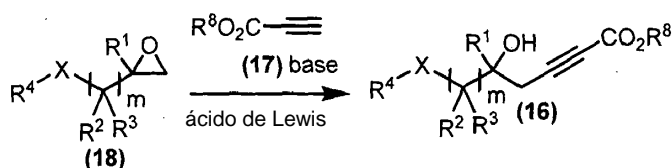
50 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro

del intervalo de -80 a 50°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

5 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, se añade un ácido a la mezcla de reacción y la mezcla de reacción resultante se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (15).

10 Procedimiento de referencia 9

El compuesto de fórmula (16) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (18) y un compuesto de fórmula (17) en presencia de una base y un ácido de Lewis.



[en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, X y m son los mismos que se han definido anteriormente]

20 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

25 Los ejemplos del compuesto de fórmula (17) que se va a utilizar en la reacción incluyen propionato de metilo y propionato de etilo.

30 La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (17) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (18).

35 Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen litios orgánicos, tales como n-butil litio, fenil litio y metil litio; amiduros de metales alcalinos, tales como diisopropilamiduro de litio, bis(trimetilsilil)amiduro de sodio, bis(trimetilsilil)amiduro de litio y potasio bis(trimetilsilil)amiduro de sodio; bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno y N,N-diisopropiletilamina; alcóxidos metálicos tales como terc-butóxido de potasio; e hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio.

40 La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 2 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (17).

45 Los ejemplos del ácido de Lewis que se va a utilizar en la reacción incluyen trifluoruro de boro. La cantidad usada del ácido de Lewis que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (18).

50 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -80 a 50°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

55 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se mezcla con agua, y se extrae con un disolvente orgánico, y se trata la capa orgánica resultante (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (16).

El compuesto de fórmula (17) es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido.

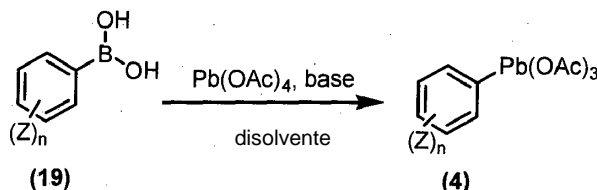
El compuesto de fórmula (18) se puede preparar de acuerdo con un método descrito en el Journal of Organic Chemistry (2009), vol. 74, págs. 9509-9512, el Journal of Organic Chemistry (2008), vol. 73, págs. 9479-9481 o el Canadian Journal of Chemistry (1981) vol. 59, págs. 1415 a 1424 o métodos similares a los mismos.

5

Procedimiento de Referencia 10

Un compuesto de fórmula (4) se pueden preparar mediante, por ejemplo, reacción de un compuesto de fórmula (19) con tetraacetato de zinc en presencia de una base de acuerdo con Marie-Luise Huber y John T. Pinhey, Journal of Chemical Society Perkin Transion 1 (1990), pág. 721.

10



[en donde Z y n son los mismos que se han definido anteriormente]

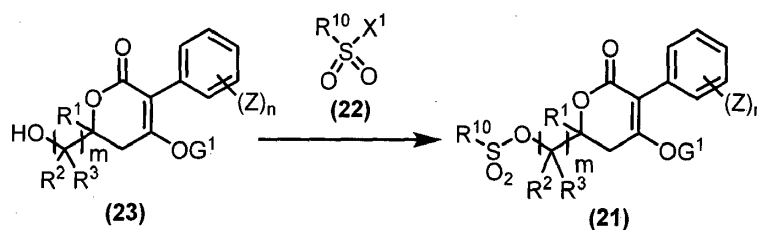
15

El compuesto de fórmula (19) es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido. Por ejemplo, el compuesto de fórmula (19) se puede preparar de acuerdo con un método descrito en el documento JP 2008-133252 A o un método similar al mismo.

Procedimiento de Referencia 11

El compuesto de fórmula (21) se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula (23) y un compuesto de una fórmula (22).

20



25

[en donde,  $R^{10}$ ,  $X^1$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $N$ ,  $m$ ,  $G^1$  y  $Z$  son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

30

Los ejemplos del compuesto de fórmula (22) que se va a utilizar en la reacción incluyen haluros sulfónicos tales como cloruro de metanosulfonilo y cloruro de p-toluenosulfonilo; anhídridos sulfónicos tales como anhídrido metanosulfónico y anhídrido trifluorometanosulfónico. La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (22) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (23).

40

La reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de una base. Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno; y bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de calcio e hidruro de sodio. La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 0,5 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (23).

45



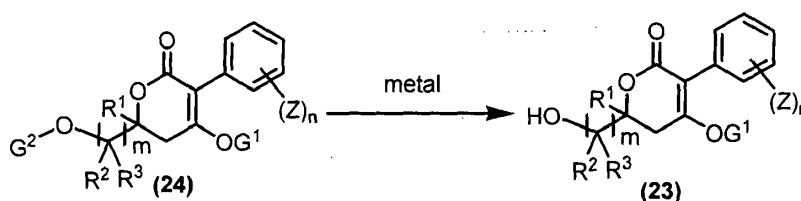
La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -30 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -10 a 50°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

5 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (21).

10 El compuesto de fórmula (22) es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido.

Procedimiento de Referencia 12

15 El compuesto de fórmula (23) se puede preparar, por ejemplo, mediante reacción de un compuesto de fórmula (24) en presencia de un metal.



20 [en donde, G<sup>2</sup> representa un grupo bencilo o un grupo para-metoxibencilo; y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, N, m, G<sup>1</sup> y Z son los mismos que se han definido anteriormente]

25 La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; alcoholes tales como metanol y etanol; ésteres tales como acetato de etilo; y mezclas disolventes de los mismos.

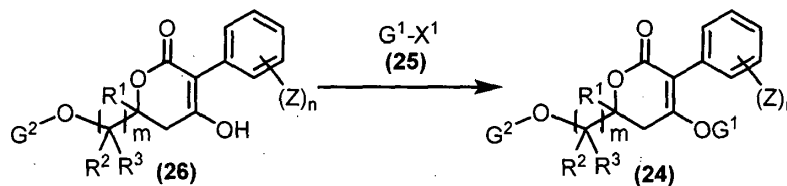
30 Los ejemplos del metal que se va a utilizar en la reacción incluyen paladio y platino. La cantidad utilizada del metal que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 0,01 equivalentes molares o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 0,01 a 0,5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (24).

35 La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -30 a 180°C y preferiblemente dentro del intervalo de -10 a 50°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

40 La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se filtran a través de Celite (marca registrada) y los productos filtrados resultantes se tratan (por ejemplo, concentración a presión reducida) para obtener el compuesto de fórmula (23).

Procedimiento de referencia 13

45 El compuesto de fórmula (24) se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula (26) y un compuesto de fórmula: G<sup>1</sup>-X<sup>1</sup> en presencia de una base.



50 [en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X<sup>1</sup>, N, m, Z, G<sup>2</sup> y G<sup>1</sup> son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno y tolueno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido; sulfonas tales como sulfolano; y mezclas disolventes de los mismos.

Los ejemplos del compuesto de fórmula:  $G^1-X^1$  que se va a utilizar en la reacción incluyen haluros carboxílicos tales como cloruro de acetilo, cloruro de propionilo, cloruro de isobutirilo, cloruro de pivaloilo, cloruro de benzoilo y cloruro de ácido ciclohexanocarboxílico; anhídridos de ácidos carboxílicos tales como anhídrido acético y anhídrido trifluoroacético; haluros de ésteres carbonato tales como cloroformiato de metilo, cloroformiato de etilo y cloroformiato de fenilo; haluros de ácidos carbámicos tales como cloruro de dimetilcarbamoilo; haluros de ácidos sulfónicos tales como cloruro de metanosulfonilo y cloruro de p-toluenosulfonilo; anhídridos de ácidos sulfónicos tales como anhídrido metanosulfónico y anhídrido trifluorometanosulfónico; éteres de alquil halogenoalquilo tales como éter clorometil metílico y éter clorometil etílico.

La cantidad utilizada del compuesto de fórmula:  $G^1-X^1$  que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (26).

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno; y bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de calcio e hidruro de sodio.

La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 0,5 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 1 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (26).

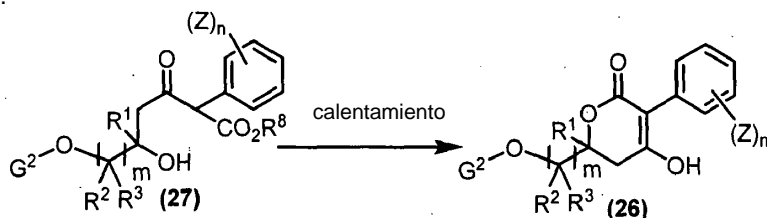
La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de  $-30$  a  $180^\circ\text{C}$  y preferiblemente dentro del intervalo de  $-10$  a  $50^\circ\text{C}$ . El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el análisis de una parte de las mezclas de reacción en métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (24).

El compuesto de fórmula:  $G^1-X^1$  es un compuesto conocido, o se puede preparar a partir de un compuesto conocido.

Procedimiento de Referencia 14

El compuesto de fórmula (26) puede prepararse por calentamiento de un compuesto de fórmula (27) en presencia o ausencia de una base.



[en donde,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^8$ ,  $N$ ,  $m$ ,  $Z$  y  $G^2$  son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente sin disolvente, y también se puede llevar a cabo en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y mezclas disolventes de los mismos, y, preferiblemente incluyen, tolueno y xileno.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina,

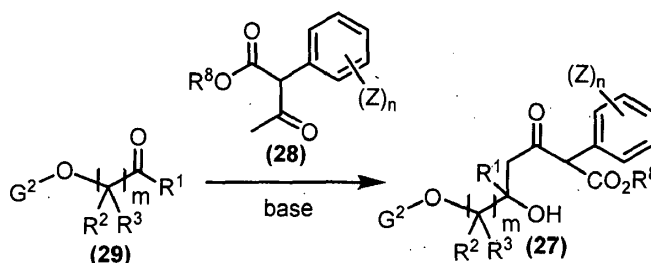
tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno. La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 a 10 equivalentes molares y preferiblemente dentro del intervalo de 2 a 5 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (27).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 100 a 200°C y preferiblemente dentro del intervalo de 130 a 180°C. El periodo de reacción de la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se acidulan con un ácido, se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (1a).

Procedimiento de referencia 15

El compuesto de fórmula (27) se puede preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (29) y un compuesto de fórmula (28) en presencia de dos equivalentes molares de una base.



[en donde,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^8$ ,  $Z$ ,  $n$ ,  $m$  y  $G^2$  son los mismos que se han definido anteriormente]

La reacción se lleva a cabo usualmente en un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano y dimetoxietano; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y 1,2-dicloroetano; y mezclas disolventes de los mismos.

La cantidad utilizada del compuesto de fórmula (28) que se va a utilizar en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 1 equivalente molar o más, y preferiblemente dentro de un intervalo de 1 a 3 equivalentes molares en oposición a 1 mol del compuesto de fórmula (29).

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen amiduros de metales alcalinos, tales como diisopropilamido de litio, bis(trimetilsilil)amido de sodio, bis(trimetilsilil)amido de litio y bis(trimetilsilil)amido de potasio; y bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de calcio, hidruro de sodio e hidruro de potasio.

La cantidad utilizada de la base que se va a emplear en la reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 2 a 10 equivalentes molares y preferiblemente 2 equivalentes molares, en comparación con 1 mol del compuesto de fórmula (29).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de -80 a 180°C y preferiblemente dentro de un intervalo de -40 a 30°C. El periodo de reacción de esta reacción se encuentra usualmente dentro del intervalo de 10 minutos a 30 horas.

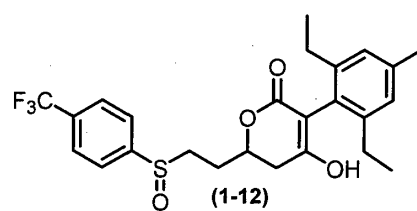
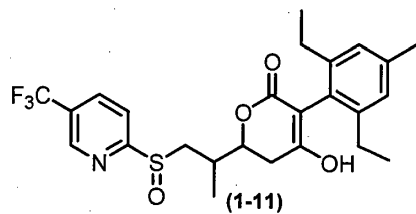
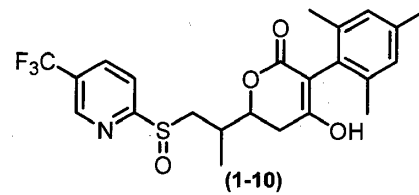
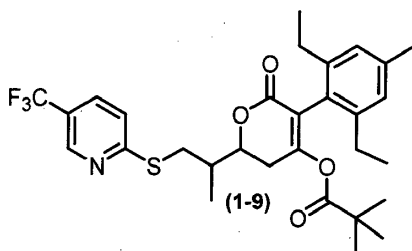
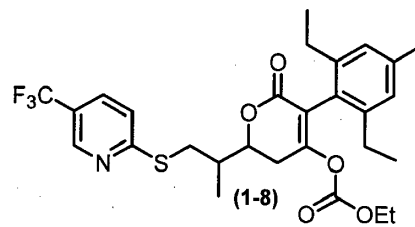
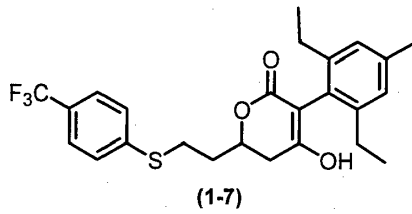
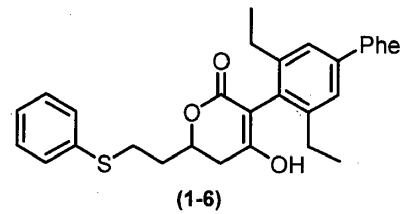
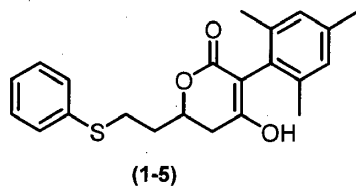
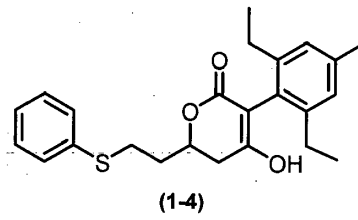
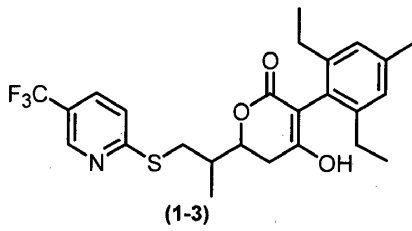
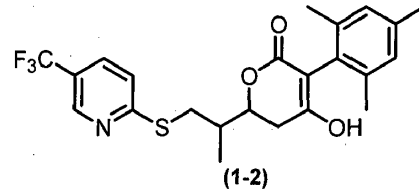
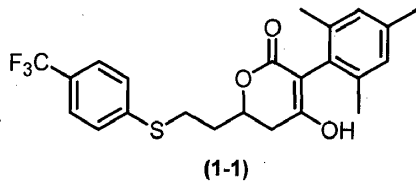
La finalización de la reacción se puede confirmar mediante el muestreo de una parte de las mezclas de reacción, seguido de la realización de métodos analíticos tales como cromatografía en capa fina y cromatografía líquida de alto rendimiento. Cuando se completa la reacción, por ejemplo, las mezclas de reacción se mezclan con agua, y se extraen con un disolvente orgánico, y las capas orgánicas resultantes se tratan (por ejemplo, secado y concentración) para obtener el compuesto de fórmula (27).

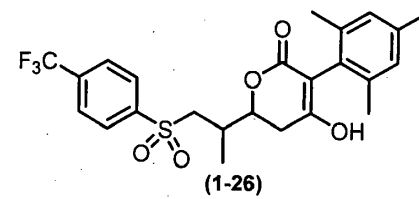
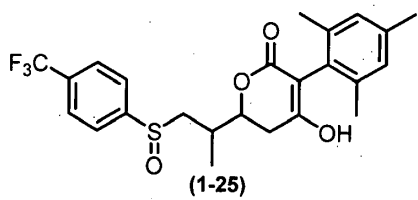
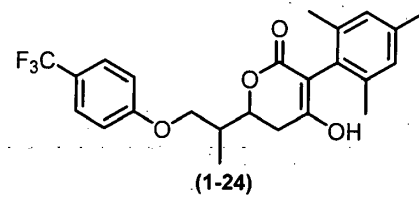
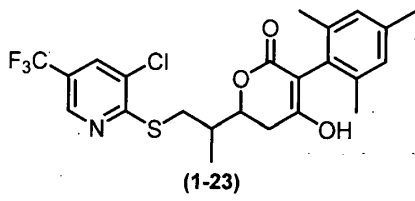
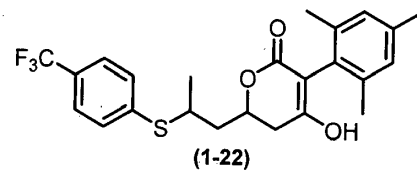
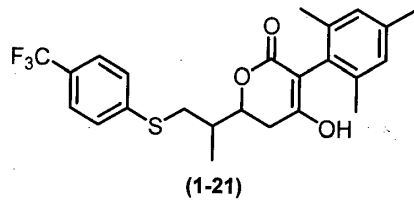
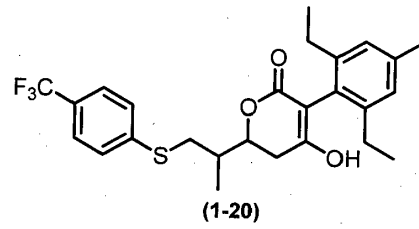
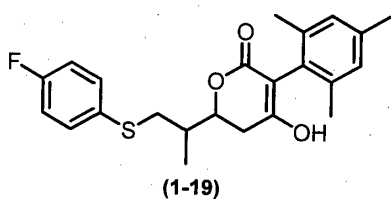
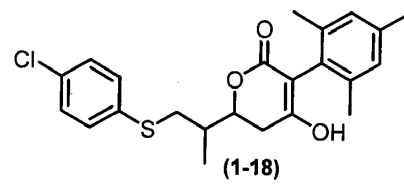
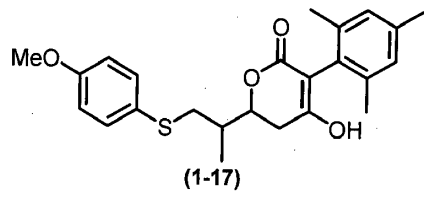
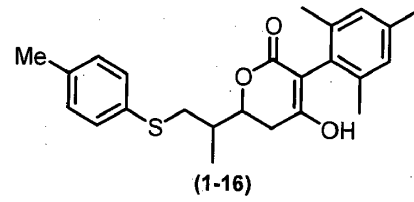
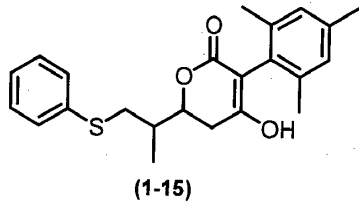
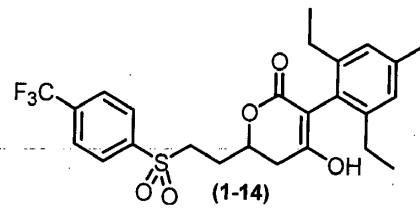
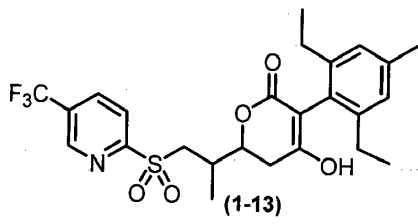
El compuesto de fórmula (28) se puede preparar, por ejemplo, de acuerdo con un método descrito en WO

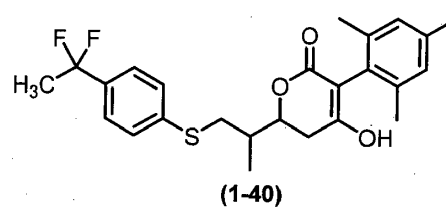
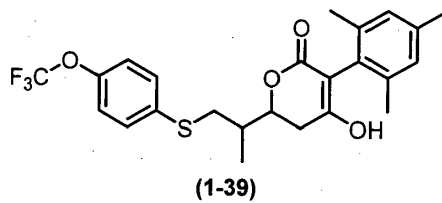
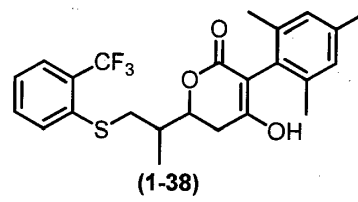
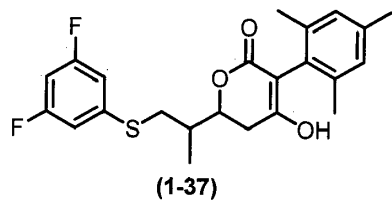
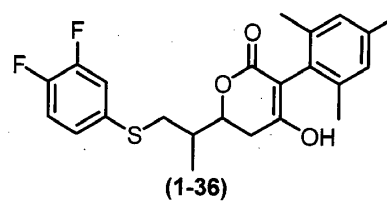
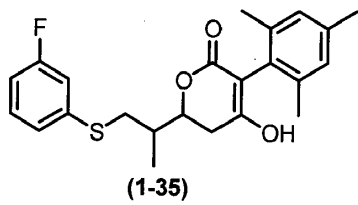
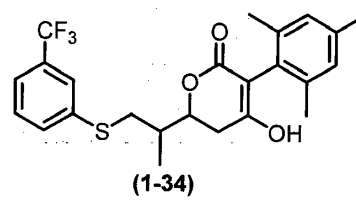
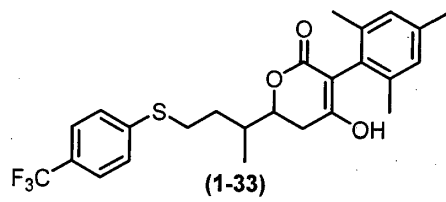
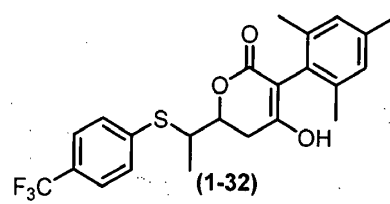
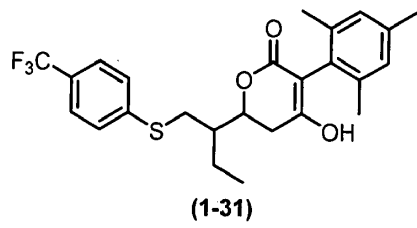
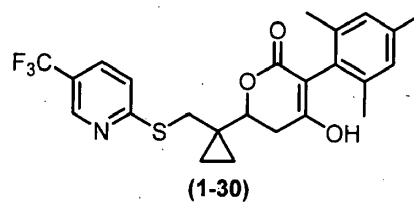
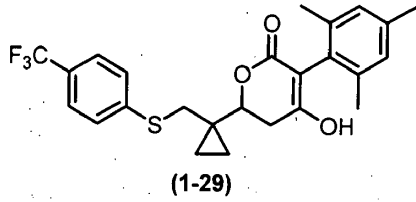
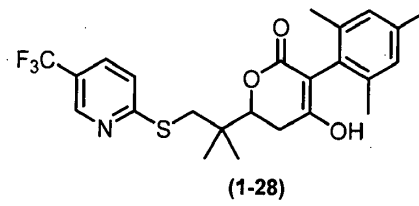
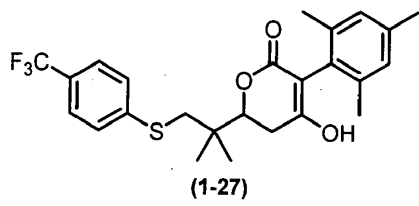
2007/144625.

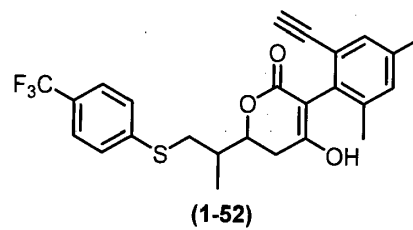
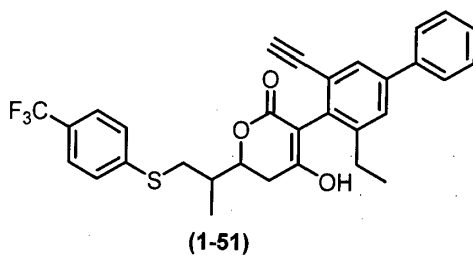
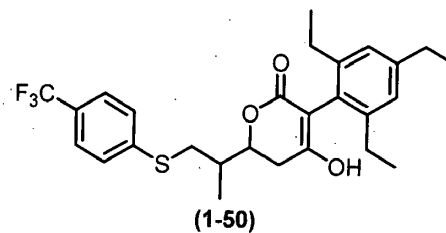
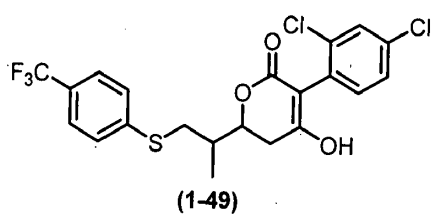
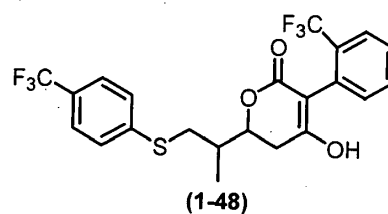
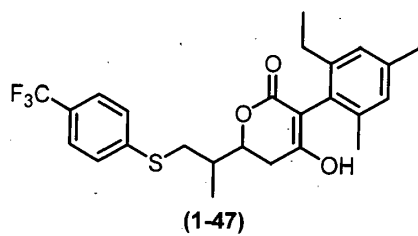
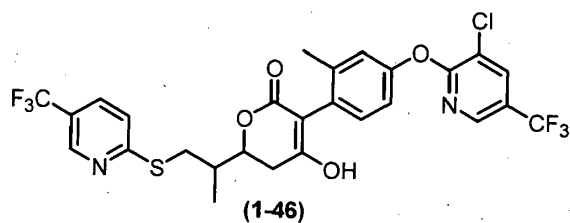
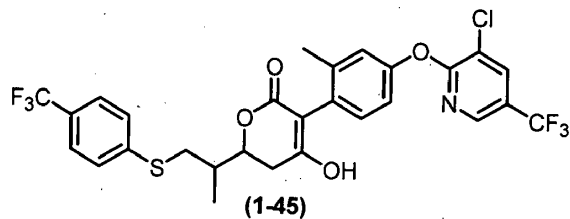
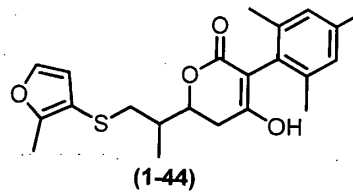
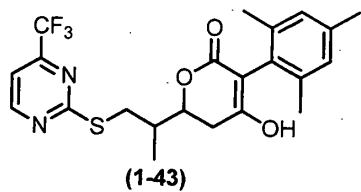
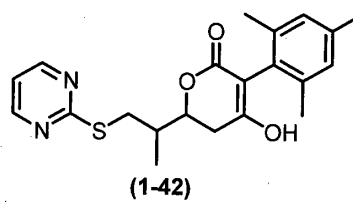
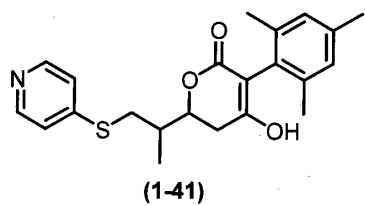
Algunos ejemplos de los presentes compuestos que se pueden preparar de acuerdo con los procedimientos anteriormente mencionados se muestran a continuación. De aquí en adelante, el compuesto de fórmula (a-b) significa el presente compuesto (a-b).

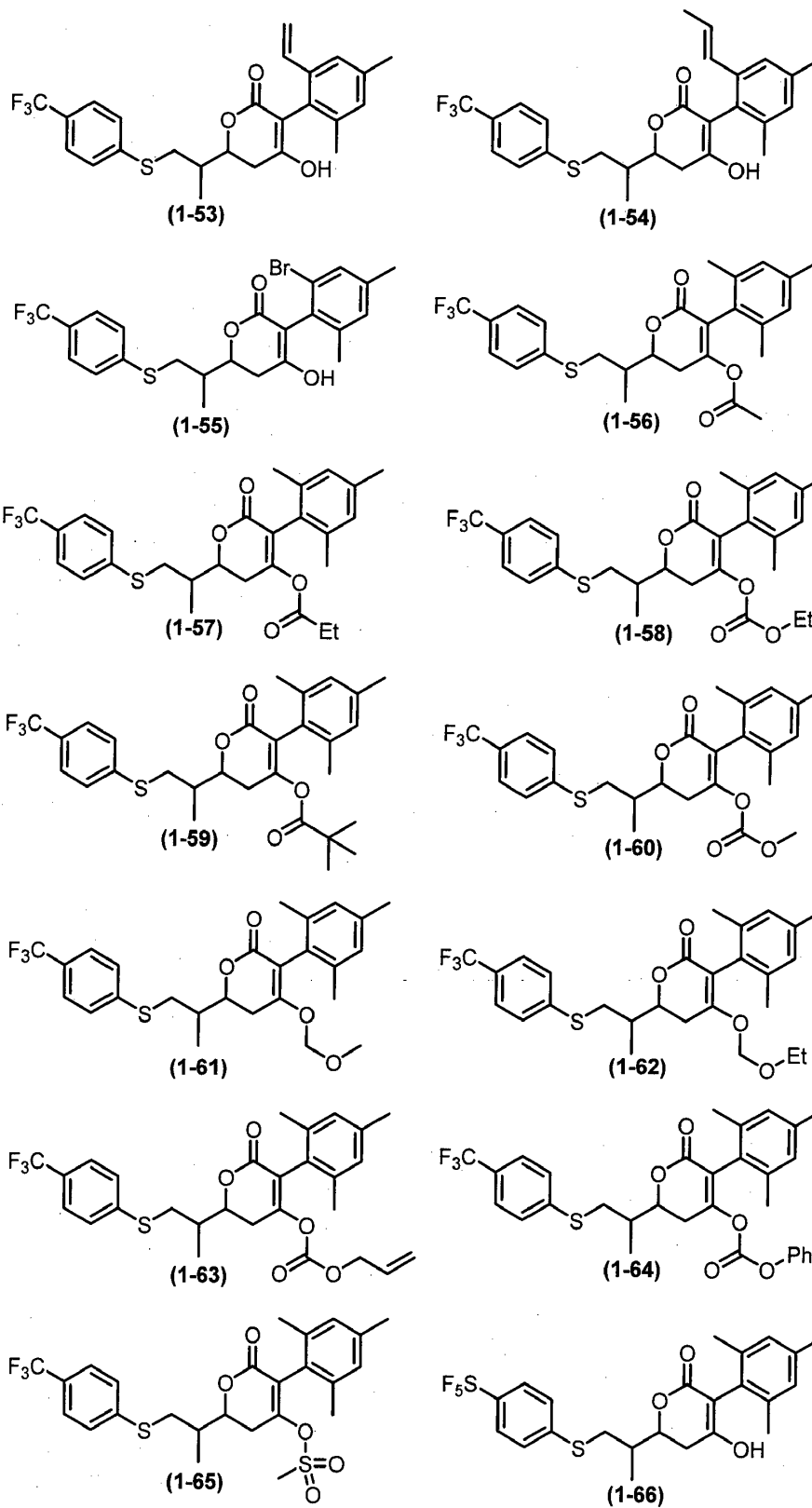
5



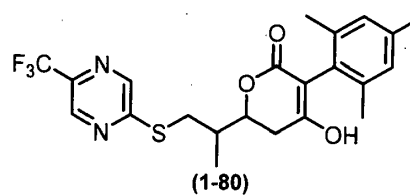
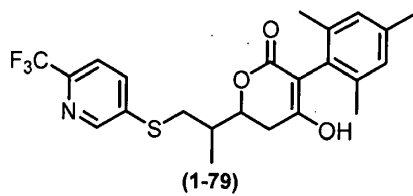
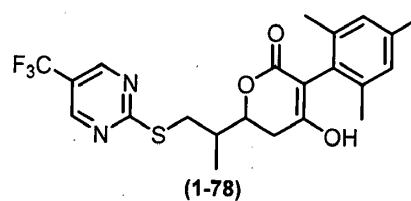
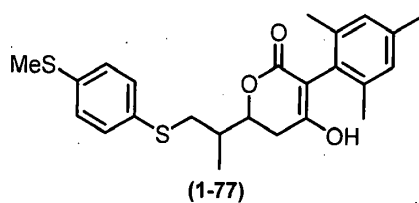
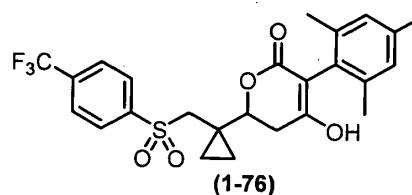
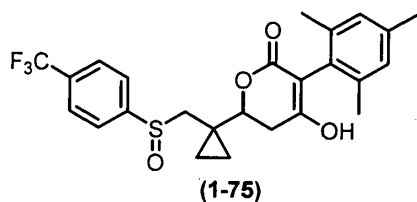
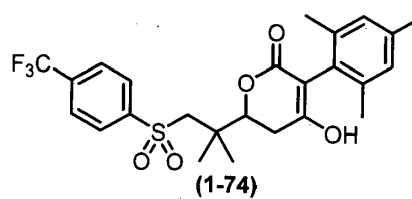
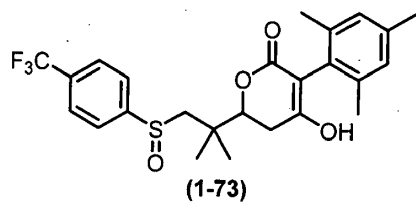
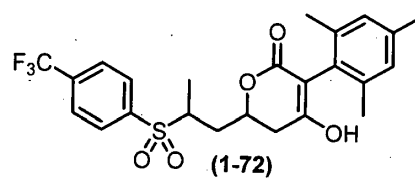
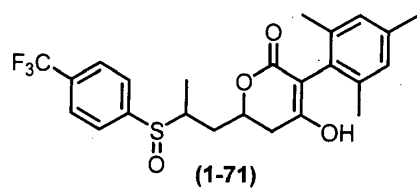
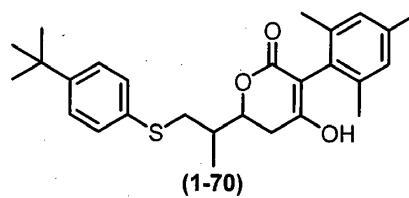
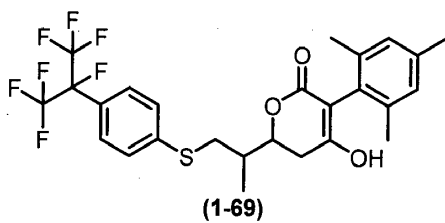
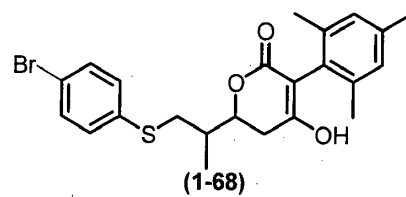
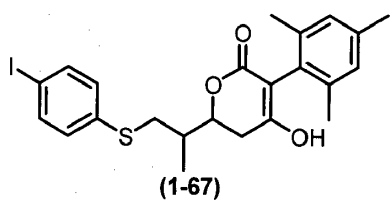


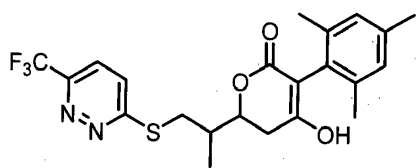




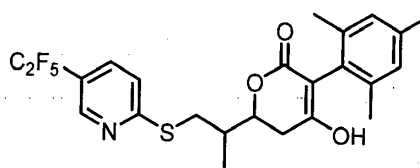




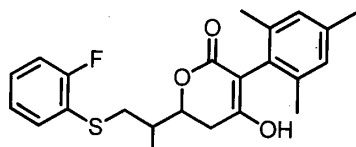




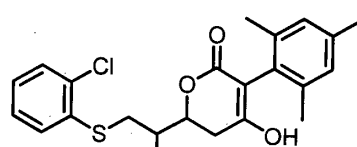
(1-81)



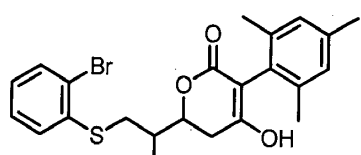
(1-82)



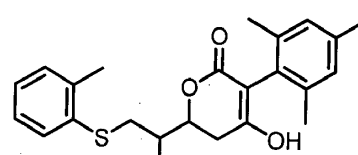
(1-83)



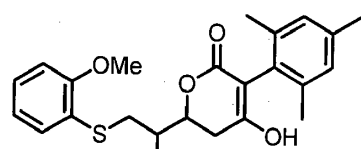
(1-84)



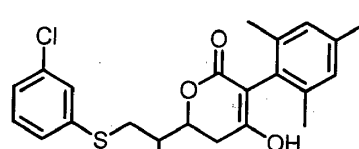
(1-85)



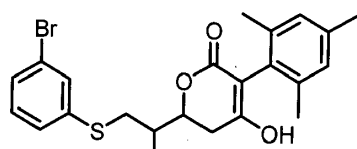
(1-86)



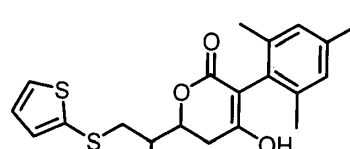
(1-87)



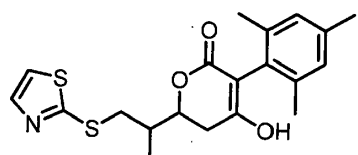
(1-88)



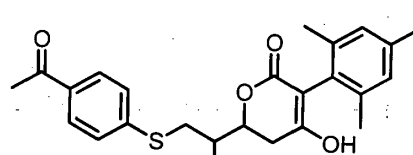
(1-89)



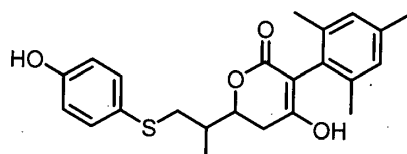
(1-90)



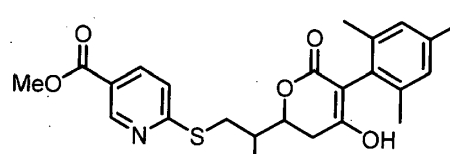
(1-91)



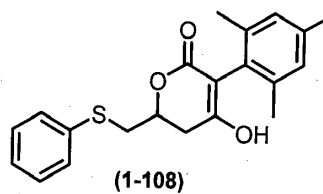
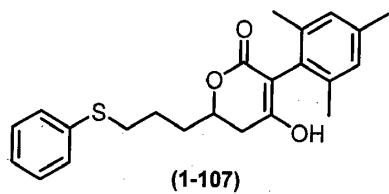
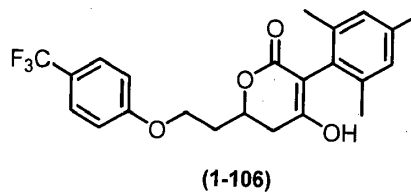
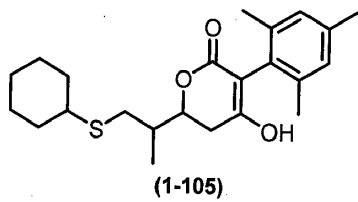
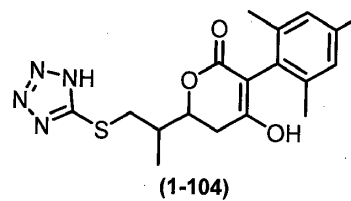
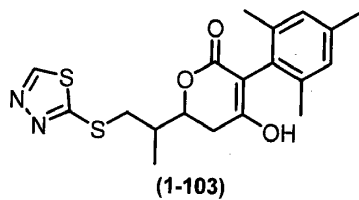
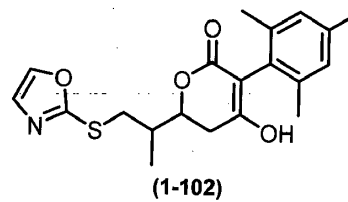
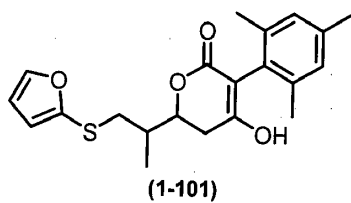
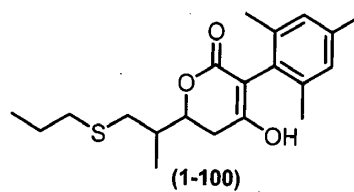
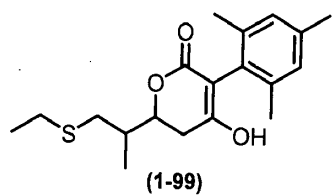
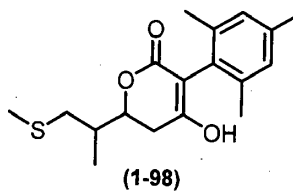
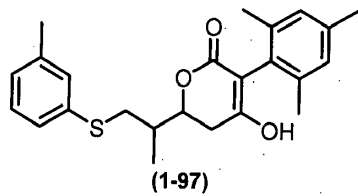
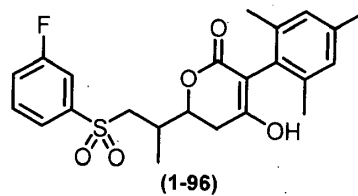
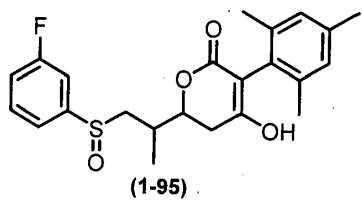
(1-92)

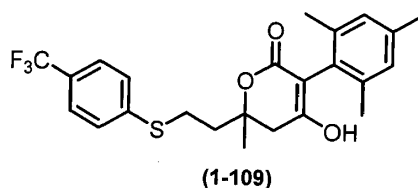


(1-93)



(1-94)





### Ejemplos

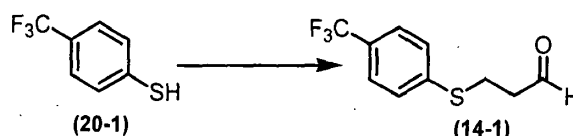
5 La presente invención se describe a continuación con más detalle con los Ejemplos de Preparación, los Ejemplos de Referencia, los Ejemplos de Formulación y los Ejemplos de Ensayo, pero no se debe considerar que la presente invención se limita a los mismos.

10 La "temperatura ambiente" (en lo sucesivo abreviada a veces como "RT") descrita en el Ejemplo de Preparación y los Ejemplos de Referencia significa usualmente de 10 a 30°C. RMN  $H^1$  significa un espectro de resonancia magnética nuclear de protón y el tetrametilsilano se utiliza como patrón interno y el desplazamiento químico ( $\delta$ ) se expresa en ppm.

15 Las siguientes abreviaturas se utilizan a veces en los Ejemplos de Preparación y los Ejemplos de Referencia.  $CDCl_3$ : Cloroformo deuterado, s: singlete, d: doblete, t: triplete, q: cuarteto, m: multiplete, Me: grupo metilo, Et: grupo etilo, Phe: grupo fenilo, OMe: grupo metoxi, EtOAc: acetato de etilo, TBS: grupo terc-butildimetilsililo, eq.: equivalente, éter de pet.: éter de petróleo y MR: mezcla de reacción.

Ejemplo de Preparación 1-1 Preparación de un compuesto de fórmula (1-1)

20 <Preparación de un compuesto de fórmula 14-1>



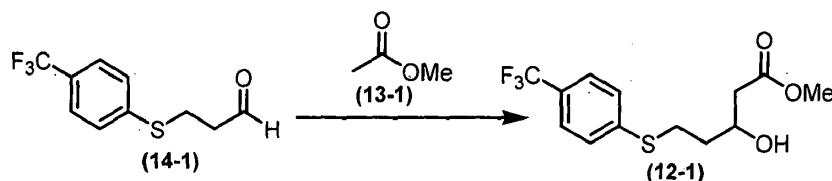
25 A RT, un compuesto de fórmula (20-1), 15 g de tetrahidrofurano y 45 ml se mezclaron y después se agitaron. La mezcla resultante se enfrió a 0°C, y a esto se añadieron a continuación 8,1 ml de acroleína (90%) y 0,4 ml de trietilamina gota a gota. La mezcla resultante se agitó enfriando con hielo durante 3 horas. A la mezcla de reacción resultante se le añadió a continuación agua. La mezcla resultante se extrajo con éter terc-butil metílico. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro*, y se concentró bajo presión reducida para proporcionar 19,8 g del compuesto de fórmula (14-1).

30 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 9,79 (1H, s), 7,54 (2H, d), 7,38 (2H, d), 3,25 (2H, t), 2,84 (2H, t)

<Preparación de un compuesto de fórmula 12-1>

35



40 En atmósfera de nitrógeno, se diluyeron 14,4 ml de diisopropilamina con 85 ml de tetrahidrofurano. La solución resultante se enfrió a -78°C y esto se le añadieron 63,4 ml de n-butillio (solución 1,63 M en hexano) gota a gota. La solución de reacción se agitó a continuación a 0°C durante aproximadamente 10 minutos y se enfrió de nuevo a -78°C, y se añadieron a la misma lentamente 8,0 ml de un compuesto de fórmula (13-1) gota a gota. La mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 1 hora. A la solución resultante se le añadieron lentamente 19,8 g de una solución diluida de un compuesto de fórmula (14-1) en 100 ml de tetrahidrofurano gota a gota durante aproximadamente 1 hora. La solución de reacción resultante se agitó a la

45 misma temperatura durante aproximadamente dos horas. A la solución de reacción se le añadieron a continuación 300 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio, y la capa orgánica se extrajo con acetato de etilo y se lavó con una solución salina saturada, y se secó sobre  $MgSO_4$  *anhidro*. La capa orgánica resultante se concentró

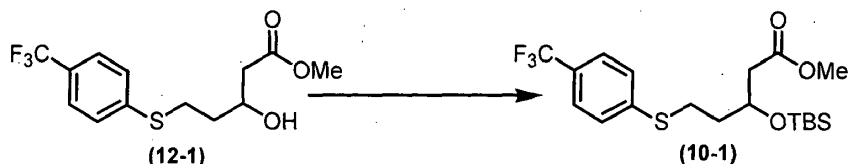
a presión reducida para proporcionar 26 g del compuesto bruto de fórmula (12-1).

RMN  $H^1$  (d-DMSO)

$\delta$  ppm: 7,51 (2H, d), 7,37 (2H, d), 4,21-4,17 (1H, m), 3,72 (3H, s), 3,24-3,04 (3H, m), 2,55-2,43 (2H, m), 1,93-1,73 (2H, m)

5

<Preparación de un compuesto de fórmula 10-1>



10

Se disolvieron 25,9 g del compuesto de fórmula (12-1) y 14,3 g de imidazol en 150 ml de N,N-dimetilformamida anhidra. A la mezcla resultante se añadieron a temperatura ambiente 15,2 g de terc-butil- dimetilclorosilano y la mezcla resultante se agitó durante aproximadamente 12 horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 200 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con terc-butil metil éter. La capa orgánica se lavó con salmuera saturada, y se secó sobre  $MgSO_4$  *anhidro* y se concentró a presión reducida para proporcionar un producto en bruto de un compuesto de fórmula (10-1). El producto bruto se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:20) para proporcionar el compuesto de fórmula (10-1) 34 g de un aceite de color amarillo pálido.

15

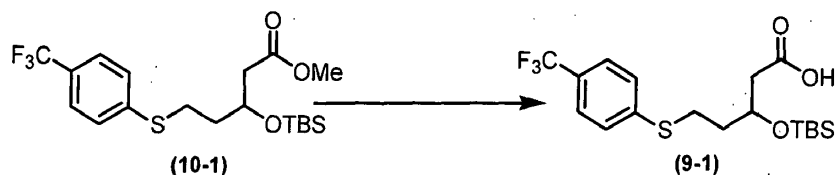
RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,51 (2H, d), 7,35 (2H, d), 4,30-4,24 (1H, m), 3,65 (3H, s), 3,09-2,95 (2H, m), 2,50 (2H, ddd), 1,87 (2H, td), 0,88 (9H, s), 0,07 (3H, s), 0,06 (3H, s)

20

<Preparación de un compuesto de fórmula 9-1>

25



30

Se disolvieron 34 g del compuesto de fórmula (10-1) en una mezcla disolvente de 60 ml de tetrahydrofurano y 40 ml de agua. A la solución resultante se le añadieron 8,45 g de monohidróxido de hidróxido de litio y la mezcla resultante se calentó a reflujo durante aproximadamente 4 horas. La solución de reacción resultante se enfrió a continuación a RT y a esto se le añadieron 130 ml de ácido clorhídrico 3N, y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica obtenida se secó sobre  $MgSO_4$  *anhidro* y se filtró. El producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida para proporcionar 31,8 g de un compuesto de fórmula (9-1).

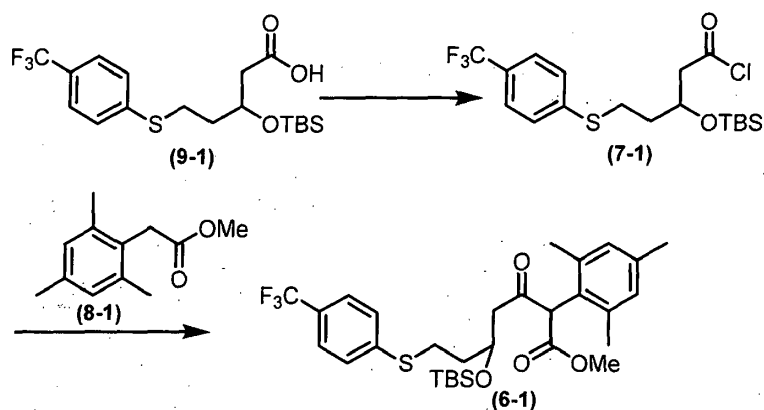
RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,51 (2H, d), 7,35 (2H, d), 4,31-4,25 (1H, m), 3,12-2,96 (2H, m), 2,56-2,53 (2H, m), 1,90 (2H, td), 0,89 (9H, s), 0,09 (6H, s)

35

<Preparación de un compuesto de fórmula 6-1>

40



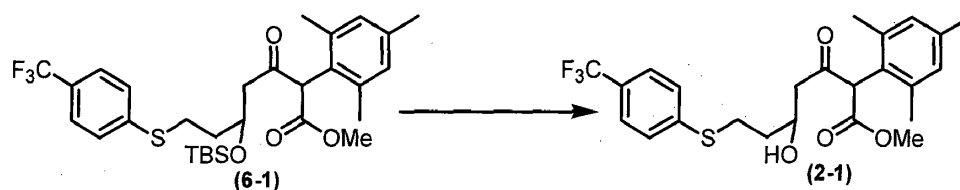
A 0°C enfriando con hielo, se disolvieron 2,0 g de un compuesto de fórmula (9-1) en 40 ml de cloroformo deshidratado, y a la solución resultante se le añadieron 0,78 ml de 1-cloro-2-metil-1-propenildimetilamina. Después, la mezcla resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante aproximadamente 3 horas. La solución de reacción resultante se concentró a presión reducida.

En atmósfera de nitrógeno, se diluyeron 1,67 ml de diisopropilamina con 18 ml de tetrahidrofurano y la solución resultante se enfrió a -78°C y a esto se le añadieron 6,7 ml de n-butil litio (solución 1,63 M en hexano) gota a gota. La solución de reacción se agitó a continuación a 0°C durante aproximadamente 10 minutos y se enfrió de nuevo a -78°C. A esto se le añadieron lentamente 1,0 g de una solución de un compuesto de fórmula (8-1) en 6 ml de tetrahidrofurano gota a gota y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 1 hora. A la solución resultante se añadieron lentamente 12 ml de una solución de un compuesto de fórmula (7-1) en tetrahidrofurano gota a gota. La solución de reacción resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 5 horas. La solución de reacción resultante se vertió en 100 ml de ácido clorhídrico 0,5 N, y la capa orgánica se extrajo con acetato de etilo y se lavó con salmuera saturada, y se secó sobre MgSO<sub>4</sub> *anhidro*. La capa orgánica resultante se concentró a presión reducida para proporcionar 3,35 g de producto bruto de un compuesto de fórmula (6-1). El aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna usando (SiO<sub>2</sub>) eluyendo con EtOAc:hexano (1: 99) para proporcionar 640 mg de un compuesto de fórmula (6-1).

RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

δ ppm: 13,19 (1H, s), 7,62 (2H, d), 7,44 (2H, d), 7,00-6,98 (2H, m), 4,20-4,14 (1H, m), 3,80 (3H, s), 3,05 -3,00 (2H, m), 2,44-2,35 (5H, m), 2,18-2,15 (6H, m), 1,95-1,79 (2H, m), 0,95 (9H, s), 0,14 (3H, s), 0,08 (3H, s)

<Preparación de un compuesto de fórmula 2-1>

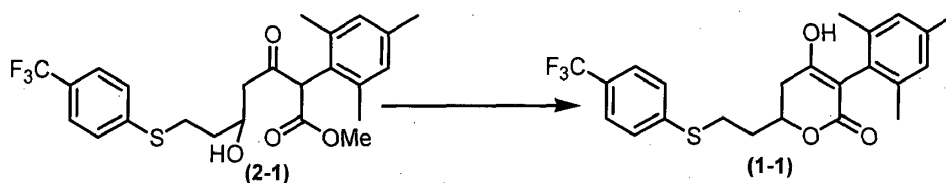


Se disolvieron 640 mg del compuesto de fórmula (6-1) en tetrahidrofurano 5 ml. A la mezcla resultante se le añadieron a temperatura ambiente 1,44 ml de fluoruro de tetrabutilamonio gota a gota y la mezcla de reacción se agitó a RT durante 4 horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 30 ml de ácido clorhídrico 0,5 N y 30 ml de acetato de etilo y la capa orgánica se separó. La capa orgánica obtenida se secó sobre MgSO<sub>4</sub> *anhidro* y se concentró a presión reducida hasta un producto bruto de un compuesto de fórmula (2-1) 570 mg.

RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

δ ppm: 13,34 (1H, s), 7,49 (2H, d), 7,31 (2H, d), 6,86 (2H, s), 4,13-4,06 (1H, m), 3,69 (3H, s), 3,35-3,30 (2H, s), 3,09-2,92 (2H, m), 2,31-2,04 (12H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-1>

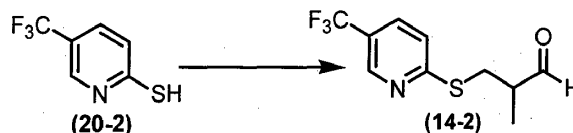


En atmósfera de nitrógeno, 570 mg del compuesto de fórmula (2-1) se calentaron a reflujo con agitación en un baño de aceite que ajustó a una temperatura externa de 150°C durante aproximadamente 30 minutos. La mezcla resultante se enfrió a continuación a RT y el aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando (SiO<sub>2</sub>) eluyendo con EtOAc:hexano (1: 2) para proporcionar un 154 mg de un compuesto de fórmula (1-1). RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

δ ppm: 7,54 (2H, d), 7,41 (2H, d), 6,96 (2H, s), 5,79 (1H, s), 4,75-4,68 (1H, m), 3,35-3,17 (2H, m), 2,78 -2,53 (2H, m), 2,32-2,01 (11H, m)

Ejemplo de preparación 1-2: Preparación de un compuesto de fórmula (1-2)

<Preparación de un compuesto de fórmula 14-2>

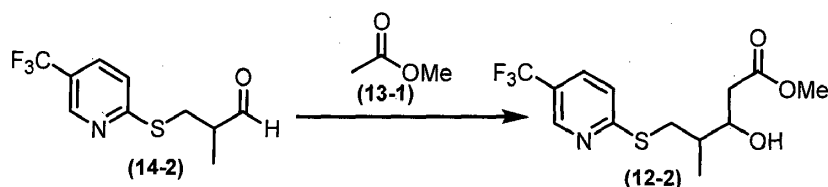


A RT, se mezclaron 15 g de un compuesto de fórmula (20-2) y 90 ml tetrahidrofurano y se agitaron, y la mezcla resultante se enfrió a 0°C y a esto se añadieron a continuación 9,0 ml de metacroleína y 1,1 ml de trietilamina gota a gota, sucesivamente, y la mezcla resultante se agitó bajo durante 5 horas enfriando con hielo. A la mezcla resultante se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con terc-butil metil éter. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro* y se concentró a presión reducida hasta un compuesto de fórmula (14-2) 20,8 g.

RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

δ ppm: 9,73 (1H, s), 8,66 (1H, s), 7,67 (1H, d), 7,27 (1H, d), 3,59-3,54 (1H, m), 3,38-3,33 (1H, m), 2,86-2,81 (1H, m), 1,26 (3H, d)

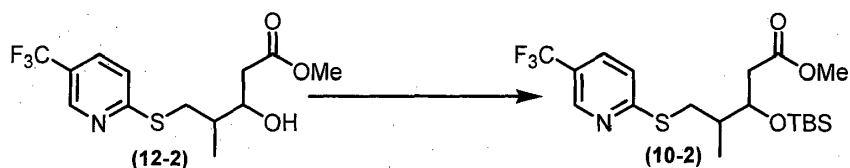
<Preparación de un compuesto de fórmula 12-2>



En atmósfera de nitrógeno, se diluyeron 14,0 ml de diisopropilamina con 85 ml de tetrahidrofurano, y la solución resultante se enfrió a -78°C y después se añadieron a esto 62,3 ml de n-butil litio (solución 1,63 M en hexano) gota a gota. La solución de reacción se agitó a continuación a 0°C durante aproximadamente 10 minutos y se enfrió a -78°C de nuevo, y se añadieron a la misma lentamente 8,0 ml de una solución diluida de un compuesto de fórmula (13-1) en 45 ml de tetrahidrofurano gota a gota y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 1 hora. A la solución resultante se le añadieron lentamente 20,8 g de una solución diluida de un compuesto de fórmula (14-2) en 100 ml de tetrahidrofurano gota a gota durante aproximadamente 1 hora. La solución de reacción resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 2 horas. A la solución de reacción anteriormente mencionada se le añadieron a continuación 330 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio, y la capa orgánica se extrajo con acetato de etilo y se lavó con una solución salina saturada, y se secó sobre MgSO<sub>4</sub> *anhidro*. La capa orgánica obtenida se concentró a presión reducida para proporcionar 18,5 g de producto bruto de un compuesto de fórmula (12-2). RMN H<sup>1</sup> (d-DMSO)

δ ppm: 8,63 (1H, s), 7,68 (1H, d), 7,34-7,30 (1H, m), 4,69-4,26 (1H, m), 4,07-3,88 (1H, m), 3,71 (3H, d), 3,53-3,41 (1H, m), 3,39-3,00 (1H, m), 2,66-2,57 (1H, m), 2,52-2,41 (1H, m), 1,7-1,2 (3H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 10-2>

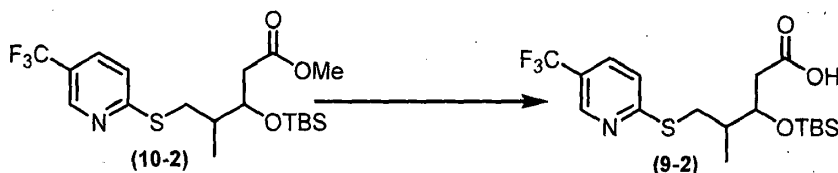


Se disolvieron 18,3 g del compuesto de fórmula (12-2) y 9,62 g de imidazol en 150 ml de N,N-dimetilformamida anhidra. A la mezcla resultante se le añadieron a RT 10,2 g de terc-butil dimetilclorosilano y la mezcla resultante se agitó durante aproximadamente doce horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 200 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con terc-butil metil éter. La capa orgánica se lavó con una solución salina saturada y se secó sobre MgSO<sub>4</sub> anhidro y se concentró a presión reducida para proporcionar el producto bruto de un compuesto de fórmula (10-2). El producto bruto se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando (SiO<sub>2</sub>) eluyendo con EtOAc:hexano (1:10) para proporcionar 15,1 g de un compuesto de fórmula (10-2) en forma de aceite de color amarillo pálido.

RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

δ ppm: 8,63 (1H, s), 7,64 (1H, d), 7,26 (1H, d), 4,36-4,24 (1H, m), 3,66 (3H, d), 3,48-3,31 (1H, m), 3,11-2,81 (1H, m), 2,62-2,44 (2H, m), 2,05-1,90 (1H, m), 1,03 (3H, dd), 0,87 (9H, d), 0,11-0,03 (6H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 9-2>

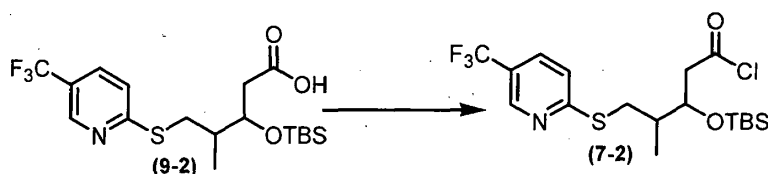


Se añadieron 15 g de un compuesto de fórmula (10-2) a una mezcla disolvente de 27 ml de tetrahidrofurano y 18 ml de agua. A la solución resultante se le añadieron 2,1 g de hidróxido de litio al 98% y la mezcla resultante se calentó a reflujo durante aproximadamente 4 horas. La solución de reacción resultante se enfrió a RT, y a la solución de reacción se le añadieron 100 ml de una solución acuosa 0,1 N de hidrogenosulfato de sodio para lograr pH 3. Después, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica obtenida se secó sobre MgSO<sub>4</sub> anhidro y se filtró. El producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida para proporcionar un compuesto de fórmula (9-2) 14,7 g.

RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

δ ppm: 8,65 (1H, s), 7,64 (1H, d), 7,26 (1H, d), 4,35-4,23 (1H, m), 3,48-3,33 (1H, m), 3,10-2,82 (1H, m), 2,67-2,51 (2H, m), 2,07-1,97 (1H, m), 1,9-1,2 (3H, m), 0,91-0,84 (9H, m), 0,11-0,05 (6H, m)

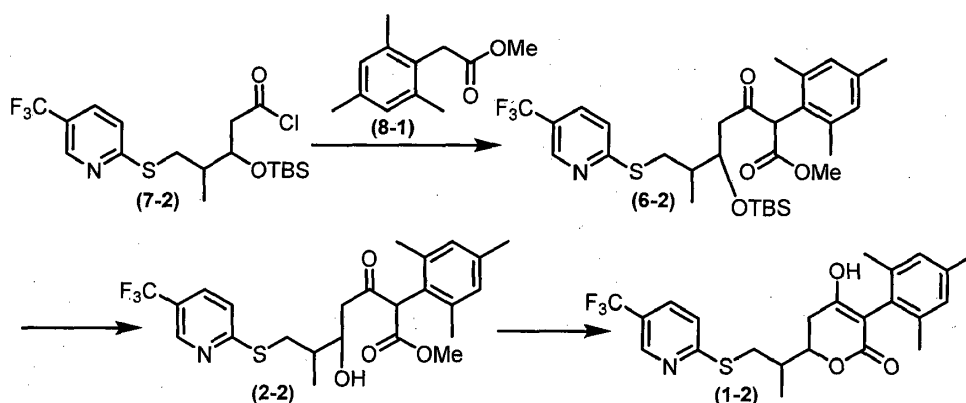
<Preparación de un compuesto de fórmula 7-2>



A 0°C enfriando con hielo, se disolvieron 2 g de un compuesto de fórmula (9-2) en 40 ml de cloroformo deshidratado y a la solución resultante se le añadieron 0,75 ml de 1-cloro-2-metil-1-propenildimetilamina, y después la mezcla resultante se elevó a RT y se agitó durante aproximadamente 3 horas. La solución de reacción resultante se concentró a presión reducida para proporcionar el producto bruto de un compuesto de fórmula (7-2). El compuesto de fórmula (7-2) se utilizó en la siguiente reacción sin purificación adicional.

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-2>





En atmósfera de nitrógeno, se diluyeron 3,8 ml de diisopropilamina con 50 ml de tetrahydrofurano y la solución resultante se enfrió a -78°C, y después se añadieron a esto 16 ml de n-butil litio (solución 1,63 M en hexano) gota a gota. La solución de reacción se agitó a continuación a 0°C durante aproximadamente 10 minutos y se enfrió a -78°C de nuevo. A esto se le añadieron lentamente 2,4 g de una solución de un compuesto de fórmula (8-1) en 30 ml de tetrahydrofurano gota a gota, y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 1 hora. A la solución resultante se le añadieron lentamente 15 ml de una solución de un compuesto de fórmula (7-2) en tetrahydrofurano gota a gota. La solución de reacción resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 5 horas. La solución de reacción resultante se vertió en 260 ml de ácido clorhídrico 1 N, y la capa orgánica se extrajo con acetato de etilo y se lavó con una solución salina saturada y después se secó sobre MgSO<sub>4</sub> *anhidro*. La capa orgánica obtenida se concentró a presión reducida para proporcionar 9,27 g del producto bruto de un compuesto de fórmula (6-2).

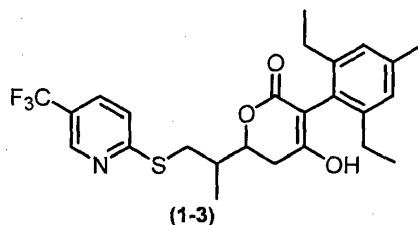
Sucesivamente, 9,27 g del producto bruto del compuesto de fórmula (6-2) se disolvieron en 150 ml de tetrahydrofurano. A la mezcla resultante se le añadieron a RT 16,2 ml de fluoruro de tetrabutilamonio gota a gota y la mezcla resultante se agitó a RT durante 4 horas. A la mezcla de reacción se añadieron agua y 30 ml de acetato de etilo y la capa orgánica se separó. La capa orgánica obtenida se secó sobre MgSO<sub>4</sub> *anhidro* y después se concentró a presión reducida para proporcionar 2,5 g del producto bruto de un compuesto de fórmula (2-2).

En atmósfera de nitrógeno, 2,5 g del producto bruto de un compuesto de fórmula (2-2) se calentaron en baño de aceite ajustado a una temperatura externa de 150°C durante aproximadamente 30 minutos. La mezcla de reacción se enfrió a continuación hasta la RT y el aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando (SiO<sub>2</sub>) eluyendo con EtOAc:hexano (1: 2) para proporcionar 166,8 mg de un compuesto de fórmula (1-2).

RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)  
 δ ppm: 8,61 (1H, d), 7,66 (1H, dd), 7,28 (1H, dd), 6,88 (2H, s), 4,67-4,42 (1H, m), 3,66-3,61 (0,5H, m), 3,43 (0,5H, dd), 3,24 (0,5H, dd), 3,10 (0,5H, dd), 2,83-2,73 (1H, m), 2,49-2,24 (5H, m), 2,07 (6H, s), 1,20 -1,13 (3H, m)

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-2 utilizando éster metílico del ácido 2,6-dietil-4-metilfenilacético en lugar de un compuesto de fórmula (8-1).

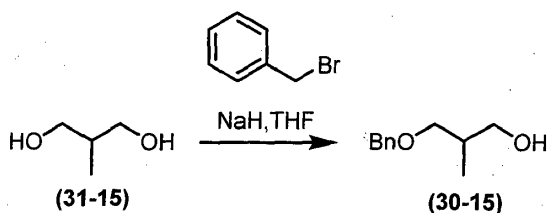
<Compuesto de fórmula 1-3>



RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)  
 δ ppm: 8,67-8,65 (1H, m), 7,68 (1H, dd), 7,33-7,28 (1H, m), 7,00 (1H, s), 6,97 (1H, s), 6,06 (1H, s), 4,72 -4,68 (1H, m), 3,72-3,48 (1H, m), 3,31-3,15 (1H, m), 2,94-2,85 (1H, m), 2,61-2,17 (9H, m), 1,29-1,02 (9H, metro)

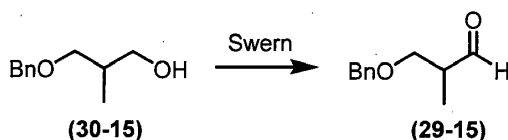
Ejemplo de Preparación 1-3: Preparación de un compuesto de fórmula (1-15)

<Preparación de un compuesto de fórmula 30-15>



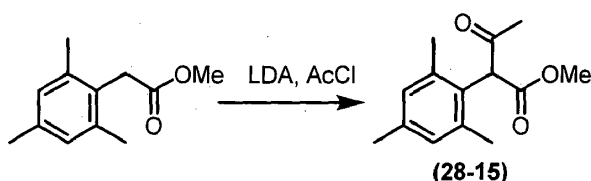
5 A una suspensión de NaH (40 g, 1666,69 mmoles) en THF seco (1000 ml) se le añadió 2-metilpropano-1,3-diol (31-15) (150 g, 1666,69 mmoles; 1 eq.) en THF seco (500 ml) a 0°C durante un período de 10 min. La mezcla de reacción se calentó a 50°C durante 1 h. A la misma temperatura se añadió bromuro de bencilo (98,89 g, 555,57 mmoles) y la mezcla de reacción se calentó a 65°C durante 12 h. Después de la finalización, la mezcla de reacción se vertió en una solución saturada de NH<sub>4</sub>Cl, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 60-120), eluyendo con EtOAc al 20%/éter de pet. para proporcionar 3-(benciloxi)-2-metil-1-ol (30-15) en forma de un líquido de color pardo (117 g, 78%); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,38-7,24 (m, 5H), 4,52 (s, 2H), 3,61 (dt, *J* = 6,7, 4,2 Hz, 2H), 3,59-3,50 (m, 1H), 3,43 (dd, *J* = 9,1, 8,0 Hz, 1H), 2,56 (dd, *J* = 6,5, 4,2 Hz, 1H), 2,14-2,01 (m, 1H), 0,89 (d, *J* = 7,0 Hz, 3H); Masa (M + H): 181, Pureza mediante LCMS: 66,04%.

15 <Preparación de un compuesto de fórmula 29-15>



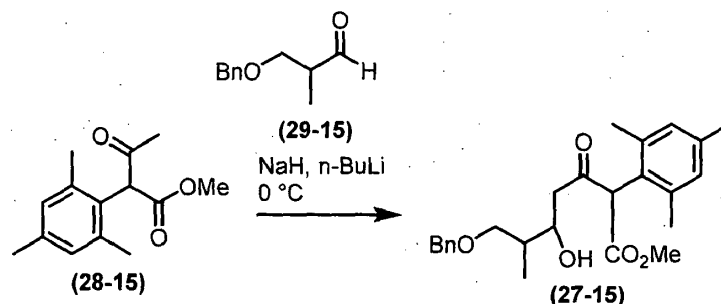
20 A una solución de dimetilsulfóxido (62 ml, 833,1 mmoles) en diclorometano (100 ml) se le añadió cloruro de oxalilo (38,5 ml, 416,55 mmoles) a -78°C y la mezcla de reacción se agitó durante 20 min. y se añadió 3-(benciloxi)-2-metil-1-ol (30-15) (50 g, 277,7 mmoles) en diclorometano seco (400 ml) a la mezcla de reacción y de nuevo se agitó durante 20 min a -78°C. Seguido de la adición de trietilamina (168 mL, 11110,8 mmoles) a -78°C y se agitó a RT durante 18 h. Después de la finalización, la MR se diluyó con agua, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 60-120), eluyendo con EtOAc al 5%/éter de pet. para proporcionar 3-(benciloxi)-2-metilpropanal (29-15) en forma de un líquido de color pardo (37 g, 75%); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 9,73 (d, *J* = 1,6 Hz, 1H), 7,44-7,20 (m, 5H), 4,53 (s, 2H), 3,65 (td, *J* = 9,6, 6,0 Hz, 2H), 2,73-2,62 (m, 1H), 1,14 (d, *J* = 70,1 Hz, 3H); Masa (M + H): 179, Pureza mediante LCMS: 84,57%.

30 <Preparación de un compuesto de fórmula 28-15>



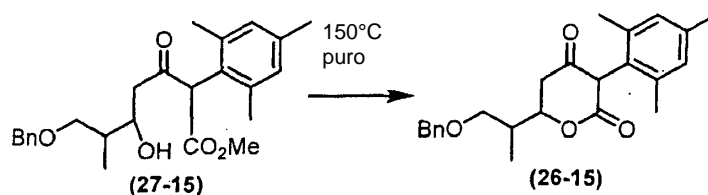
35 A la solución de 2-mesitilacetato de metilo (86 g, 447,91 mmoles) en THF (860 ml) se le añadió LDA (286 ml, 492,7 mmoles) a -78°C y se agitó a la misma temperatura durante 30 min. seguido de la adición de cloruro de acetilo (34,9 ml, 537,49 mmoles) y la MR se agitó a la misma temperatura durante 4 h y se agitó a RT durante 3 h. Después de la finalización, la MR se sofocó con una solución saturada de cloruro de amonio a 0°C, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 1%/éter de pet. para proporcionar 2-mesitil-3-oxobutanoato de metilo (28-15) en forma de un sólido de color blanquecino (10 g, 20%); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 12,97 (d, *J* = 1,0 Hz, 1H), 6,89 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,08 (s, 6H), 1,68 (s, 3H); Masa (M + H): 235, Pureza mediante LCMS: 91,62%.

<Preparación de un compuesto de fórmula 27-15>



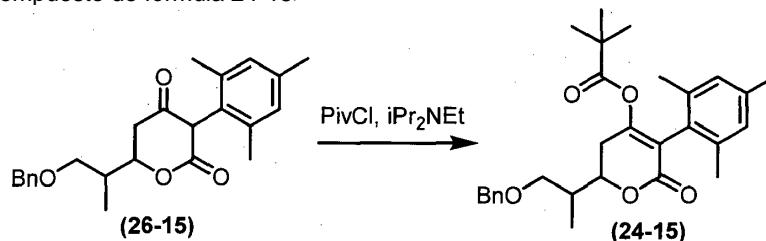
5 A una suspensión de NaH (9,4 g, 237,18 mmoles) en THF (100 ml) se le añadió la solución de 2-mesitil-3-oxobutanoato de metilo (**28-15**) (180,5 g, 79,05 mmoles) en THF (190 ml) a 0°C y se agitó durante 30 min. La MR se enfrió a -40°C, seguido de la adición de n-BuLi (197 ml, 316,23 mmoles) y se agitó durante 30 min., a la misma temperatura se añadió la solución de 3-(benciloxi)-2-metilpropanal (**29-15**) (42 g, 237,18 mmoles) en THF (40 ml) durante un período de 20 min. y se agitó a la misma temperatura durante 30 min. Después de la finalización, la MR se sofocó con una solución saturada de cloruro de amonio a 0°C, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 20%/éter de pet. para proporcionar 7-(benciloxi)-5-hidroxi-2-mesitil-6-metil-3-oxoheptanoato de etilo (**27-15**) en forma de un líquido de color pardo (26 g, 80%); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 13,26 (d, *J* = 10,0 Hz, 1H), 7,40-7,23 (m, 5H), 6,86 (d, *J* = 3,6 Hz, 2H), 4,38 (s, 2H), 4,2-3,8 (m, 1H), 3,67 (s, 3H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,27 (d, *J* = 2,0 Hz, 3H), 2,12-2,04 (m, 9H), 1,8 (s ancho, 1H) 0,79 (dd, *J* = 19,2, 7,0 Hz, 3H); Masa (M + H): 413, Pureza mediante LCMS: 84,22%.

<Preparación de un compuesto de fórmula 26-15>



25 El 7-(benciloxi)-5-hidroxi-2-mesitil-6-metil-3-oxoheptanoato de metilo (**27-15**) (26 g, 62,4 mmoles) se calentó a 150°C durante 3 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 10%/éter de pet. para proporcionar 6-(1-(benciloxi)propan-2-il)-3-mesitildihidro-2H-piran-2,4(3H)-diona (**26-15**) en forma de un líquido de color pardo (14 g, 580); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, DMSO) δ 10,66 (s, 1H), 7,39-7,26 (m, 5H), 6,84-6,77 (m, 2H), 4,56-4,39 (m, 3H), 3,62-3,39 (m, 2H), 2,81 (dt, *J* = 17,1, 12,8 Hz, 1H), 2,57-2,51 (m, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,19 a 2,4 (m, 1H), 2,00 (d, *J* = 9,0 Hz, 6H), 1,01 (t, *J* = 6,9 Hz, 3H); Masa (M + H): 380, Pureza mediante LCMS: 95,53%.

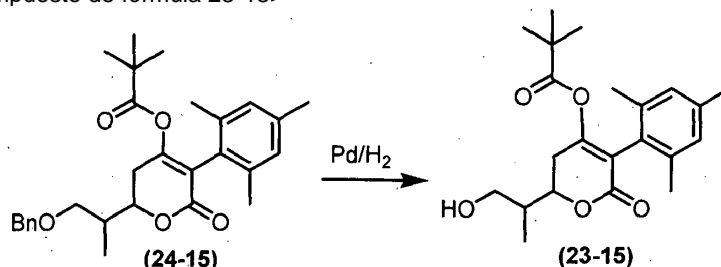
<Preparación de un compuesto de fórmula 24-15>



35 A una solución de cloruro de pivaloilo (9,3 ml, 73,16 mmoles) en piridina (77 ml) se le añadió 6-(1-(benciloxi)propan-2-il)-3-mesitildihidro-2H-piran-2,4(3H)-diona (**26-15**) (14 g, 36,40 mmoles) a RT y se agitó a la misma temperatura durante 18 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con HCl 1 N, agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a

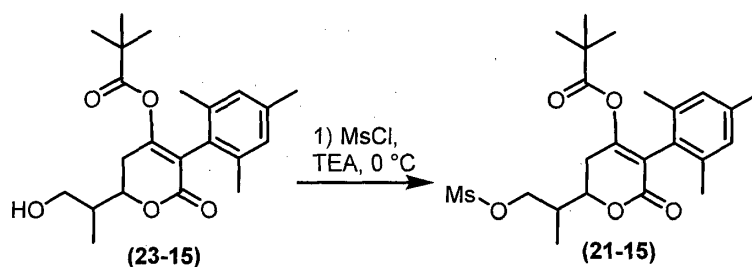
presión reducida para proporcionar 2-(1-(benciloxi)propan-2-il)-5-mesitil-6-oxo-3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo (**24-15**) en forma de una masa oleosa (14 g, 82%); RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,38-7,26 (m, 5H), 6,83 (d,  $J = 7,6$  Hz, 2H), 4,87-4,70 (m, 1H), 4,61-4,47 (m, 2H), 3,65-3,54 (m, 2H), 3,02 (ddd,  $J = 24,8, 17,4, 12,7$  Hz, 1H), 2,48 (ddd,  $J = 17,5, 9,9, 3,6$  Hz, 1H), 2,31 (p,  $J = 7,8, 7,1$  Hz, 1H), 2,24 (s, 3H), 2,14-2,09 (m, 6H), 1,12 (dd,  $J = 12,8, 7,0$  Hz, 3H), 0,92 (s, 9H); Masa (M + H): 465, Pureza mediante LCMS: 98,58%.

<Preparación de un compuesto de fórmula 23-15>



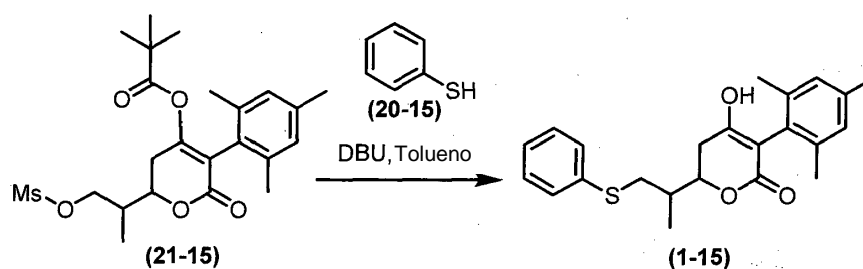
10 A una solución de 2-(1-(benciloxi)propan-2-il)-5-mesitil-6-oxo-3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo (**24-15**) (8 g, 21,39 mmoles) en EtOH de (12 ml) se le añadió Pd sobre carbono al 10% (1,6 g) y se hidrogenó a 1,36 atm durante 18 h. Después de la finalización, la MR se filtró a través de un lecho de celite y el producto filtrado se evaporó a presión reducida para proporcionar 2-(1-hidroxipropan-2-il)-5-mesitil-6-oxo-3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo (**23-15**) en forma de un sólido de color blanquecino (5,1 g, 80%); RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,83 (d,  $J = 7,6$  Hz, 2H), 4,87-4,47 (m, 2H), 3,65-3,54 (m, 2H), 3,02 (ddd,  $J = 24,8, 17,4, 12,7$  Hz, 1H), 2,48 (ddd,  $J = 17,5, 9,9, 3,6$  Hz, 1H), 2,31 (p,  $J = 7,8, 7,1$  Hz, 1H), 2,24 (s, 3H), 2,14-2,09 (m, 6H), 1,12 (dd,  $J = 12,8, 7,0$  Hz, 3H), 0,92 (s, 9H); Masa (M + H): 375, Pureza mediante LCMS: 97,80%.

<Preparación de un compuesto de fórmula 21-15>



25 A una solución de 2-(1-hidroxipropan-2-il)-5-mesitil-6-oxo-3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo (**23-15**) (10 g, 27,7 mmoles) en THF (100 ml) a 0°C se le añadió trietilamina (8 ml, 0,554 mmoles) seguido de la adición de cloruro de mesilo (2,7 ml, 34,9 mmoles) y la MR se agitó a la misma temperatura durante 2 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $Na_2SO_4$  anhidro, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para proporcionar 5-mesitil-2-(1-(metilsulfoniloxi)propan-2-il)-6-oxo-3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo (**21-15**) en forma de un sólido de color blanquecino (11 g, 91%); RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,85 (d,  $J = 7,9$  Hz, 2H), 4,89 - 4,57 (m, 1H), 4,47 - 4,25 (m, 2H), 3,06 (d,  $J = 1,7$  Hz, 2H), 2,95 (dd,  $J = 17,6, 12,0$  Hz, 1H), 2,56 (ddd,  $J = 57,4, 17,4, 3,8$  Hz, 2H), 2,42 - 2,28 (m, 1H), 2,25 (s, 3H), 2,10 (d,  $J = 2,6$  Hz, 6H), 1,19 (dd,  $J = 7,0, 3,1$  Hz, 3H), 0,93 (d,  $J = 1,5$  Hz, 9H); Masa (M + H): 453, Pureza mediante LCMS: 92,91%.

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-15>

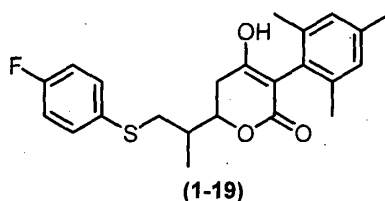


A una solución de 5-mesitil-2-(1-(metilsulfonilo)propan-2-il)-6-oxo-3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo (**20-15**) (0,639 mmoles) y el compuesto de fórmula (**20-15**) (10,27 mmoles) en tolueno (9 ml) se le añadió una solución de DBU (1,923 mmoles) gota a gota y se agitó a RT durante 2 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua, se aciduló con HCl 1 N, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> anhidro, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto (**1-15**). El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 20%/éter de pet. para proporcionar el compuesto (**1-15**).

sólido de color blanquecino (24%): RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,38 (dd, *J* = 10,5, 7,7 Hz, 2H), 7,34-7,27 (m, 3H), 6,95 (d, *J* = 5,1 Hz, 2H), 5,50 (s, 1H), 4,80-4,46 (m, 1H), 3,32 (ddd, *J* = 24,7, 13,3, 5,9 Hz, 1H), 3,01-2,69 (m, 2H), 2,44 (ddd, *J* = 46,8, 17,1, 3,7 Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,12 (d, *J* = 4,6 Hz, 7H), 1,21-1,17 (dd, 3H); Masa (M-H): 381, pureza mediante HPLC: 99,04%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 4-fluorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (**20-15**).

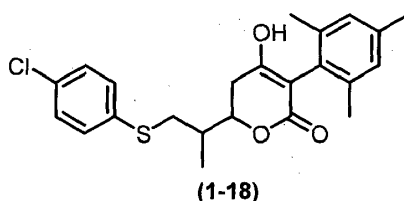
<Compuesto de fórmula 1-19>



sólido de color blanquecino (56%): RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,39 (ddd, *J* = 9,2, 7,9, 5,2 Hz, 2H), 7,05-6,92 (m, 4H), 5,56 (s, 1H), 4,75-4,42 (m, 1H), 3,34-3,18 (m, 1H), 2,94-2,67 (m, 2H), 2,44 (ddd, *J* = 49,5, 17,2, 3,7 Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,11 (d, *J* = 6,2 Hz, 6H), 2,01 (dd, *J* = 6,9, 3,5 Hz, 1H), 1,19 (dd, *J* = 16,0, 6,9 Hz, 3H); Masa (M + H): 401, pureza mediante HPLC: 97,91%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 4-clorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (**20-15**).

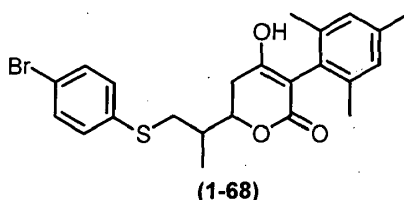
<Compuesto de fórmula 1-18>



sólido de color blanquecino (25): RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,37-7,26 (m, 4H), 6,95 (d, *J* = 2,9 Hz, 2H), 5,61 (s, 1H), 4,79-4,38 (m, 1H), 3,41-3,21 (m, 1H), 3,00-2,67 (m, 2H), 2,54 (d, *J* = 3,8 Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,11 (d, *J* = 2,4 Hz, 7H), 1,25-1,14 (m, 3H); Masa (M + H): 417, pureza mediante HPLC: 95,66%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 4-bromofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (**20-15**).

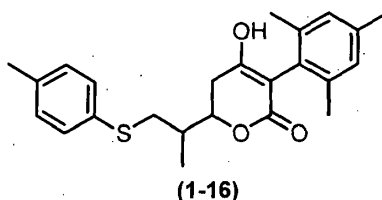
<Compuesto de fórmula 1-68>



sólido de color blanquecino (40%): RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,41 (dt, *J* = 8,3, 1,7 Hz, 2H), 7,23 (dd, *J* = 8,6, 2,1 Hz, 2H), 6,95 (d, *J* = 3,1 Hz, 2H), 5,73 (s, 1H), 4,79-4,65 (m, 1H), 3,49-3,21 (m, 1H), 3,00-2,65 (m, 2H), 2,52-2,37 (dd, *J* = 17,2, 3,5 Hz, 1H), 2,29 (d, *J* = 1,8 Hz, 3H), 2,12 (t, *J* = 2,0 Hz, 6H), 2,08-1,99 (m, 1H), 1,28-1,14 (m, 3H); Masa (M-H): 459, pureza mediante HPLC: 93,23%.

El presente compuesto como se muestra a continuación se preparó de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando p-toliltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

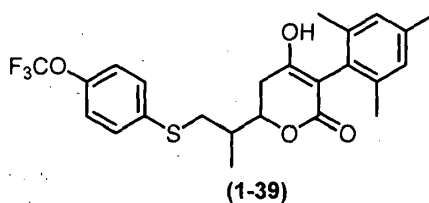
5 <Compuesto de fórmula 1-16>



10 sólido de color blanquecino (53%): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,33-7,27 (m, 2H), 7,11 (d,  $J = 7,7$  Hz, 2H), 6,95 (d,  $J = 4,6$  Hz, 2H), 5,53 (s, 1H), 4,74 (d,  $J = 13,1$  Hz, 1H), 4,55-4,46 (m, 1H), 3,32-3,19 (m, 1H), 2,97-2,68 (m, 1H), 2,42 (ddd,  $J = 41,6, 17,2, 3,7$  Hz, 1H), 2,30 (d,  $J = 12,2$  Hz, 6H), 2,12 (d,  $J = 50,8$  Hz, 7H), 1,19 (dd,  $J = 16,0, 6,8$  Hz, 3H); Masa (M + H): 397, pureza mediante HPLC: 97,74%.

15 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 4-(trifluorometoxi)feniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-39>

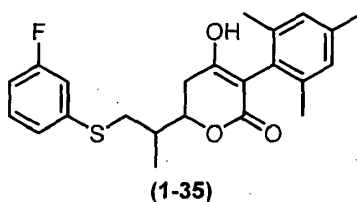


20 sólido de color blanquecino (59%): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,44-7,35 (m, 2H), 7,15 (d,  $J = 8,2$  Hz, 2H), 6,96 (d,  $J = 5,0$  Hz, 2H), 4,74-4,47 (ddd,  $J = 11,9, 7,3, 3,8$  Hz, 1H), 3,43-3,24 (m, 1H), 2,94 (ddd,  $J = 13,2, 9,2, 7,7$  Hz, 1H), 2,88-2,69 (m, 2H), 2,46 (ddd,  $J = 56,1, 17,1, 3,7$  Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,14-2,10 (m, 7H), 1,20 (dd,  $J = 19,1, 6,9$  Hz, 3H); Masa (M-H): 465, pureza mediante HPLC: 99,36%.

25 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 3-fluorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-35>

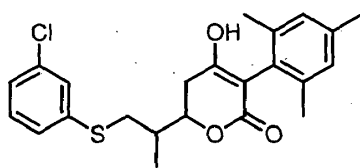
30



35 sólido de color blanquecino (49 bis): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,28 (s, 1H), 7,10 (dt,  $J = 22,4, 9,0$  Hz, 2H), 6,91 (dd,  $J = 20,2, 6,3$  Hz, 3H), 5,76 (s, 1H), 4,61 (ddt,  $J = 76,1, 12,4, 3,5$  Hz, 1H), 3,33 (dd,  $J = 26,2, 13,2, 5,5$  Hz, 1H), 2,95 (ddd,  $J = 15,6, 7,1, 3,3$  Hz, 1H), 2,88-2,67 (m, 1H), 2,44 (dd,  $J = 40,6, 17,1, 3,7$  Hz, 1H), 2,28 (s, 3H), 2,12 (d,  $J = 3,3$  Hz, 7H), 1,20 (dd,  $J = 14,6, 6,7$  Hz, 3H); Masa (M + H): 401, pureza mediante HPLC: 98,05%.

40 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 3-clorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-88>

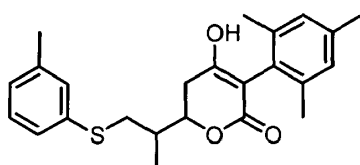


(1-88)

sólido de color blanquecino (43%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,37-7,27 (m, 1H), 7,23 (d,  $J = 5,5$  Hz, 2H), 7,20-7,10 (m, 1H), 6,95 (d,  $J = 3,4$  Hz, 2H), 5,70 (s, 1H), 4,60 (ddt,  $J = 79,0, 11,2, 3,7$  Hz, 1H), 3,33 (ddd,  $J = 24,3, 13,2, 5,7$  Hz, 1H), 3,02-2,89 (m, 1H), 2,89-2,68 (m, 1H), 2,45 (dd,  $J = 39,9, 17,2, 3,7$  Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,12 (d,  $J = 3,2$  Hz, 6H), 2,06 (s, 1H), 1,20 (dd,  $J = 14,5, 6,8$  Hz, 3H); Masa (M + H): 416, pureza mediante HPLC: 95,14%.

El presente compuesto como se muestra a continuación se preparó de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando m-toliltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-97>

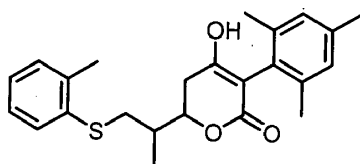


(1-97)

sólido de color blanco (61%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,19 (td,  $J = 7,5, 6,2, 1,9$  Hz, 3H), 6,97 (dd,  $J = 12,8, 4,6$  Hz, 3H), 5,49 (s, 1H), 4,80-4,45 (m, 1H), 3,29 (td,  $J = 13,9, 13,3, 5,9$  Hz, 1H), 2,99-2,87 (m, 1H), 2,87-2,69 (m, 1H), 2,44 (ddd,  $J = 34,6, 17,9, 4,5$  Hz, 1H), 2,33 (s, 6H), 2,28 (s, 6H), 2,05 (dd,  $J = 7,1, 3,5$  Hz, 1H), 1,20 (dd,  $J = 13,5, 6,8$  Hz, 3H); Masa (M + H): 397, pureza mediante HPLC: 99,47%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando o-toliltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-86>

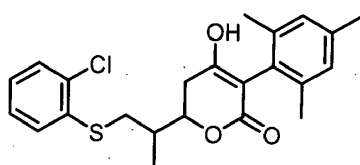


(1-86)

sólido de color blanquecino (44%): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,34 (dd,  $J = 20,2, 7,7$  Hz, 2H), 7,20-7,7 (m, 2H), 6,96 (d,  $J = 5,1$  Hz, 2H), 5,54 (s, 1H), 4,75-4,4 (m, 1H), 3,23 (d,  $J = 6,7$  Hz, 1H), 2,98-2,70 (m, 2H), 2,51 (dd,  $J = 17,0, 3,9$  Hz, 1H), 2,44-2,38 (m, 3H); 2,29 (s, 3H), 2,13 (dd,  $J = 5,4, 2,7$  Hz, 7H), 1,23 (dd,  $J = 16,5, 6,8$  Hz, 3H); Masa (M + H): 397, pureza mediante HPLC: 97,13%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 2-clorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-84>

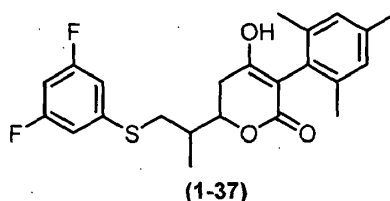


(1-84)

sólido de color blanquecino (51%): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,44-7,34 (m, 2H), 7,23 (dd,  $J = 7,8, 1,4$  Hz, 1H), 7,16-7,09 (m, 1H), 6,95 (d,  $J = 5,2$  Hz, 2H), 5,57 (s, 1H), 4,84-4,44 (m, 1H), 3,45-3,24 (m, 1H), 3,02-2,69 (m, 2H), 2,48 (ddd,  $J = 54,9, 17,1, 3,7$  Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,13 (t,  $J = 2,5$  Hz, 6H), 2,11-2,04 (m, 1H), 1,24 (dd,  $J = 15,8, 6,9$  Hz, 3H); Masa (M + H): 417, pureza mediante HPLC: 98,57%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 3,5-difluorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

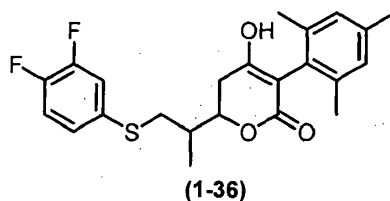
<Compuesto de fórmula 1-37>



sólido de color blanquecino (180): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,96 (d,  $J = 5,2$  Hz, 2H), 6,92-6,79 (m, 2H), 6,61 (ddd,  $J = 8,8, 7,6, 2,2$  Hz, 1H), 5,60 (s, 1H), 4,79-4,41 (m, 1H), 3,45-3,23 (m, 1H), 3,03-2,71 (m, 2H), 2,47 (ddd,  $J = 59,1, 17,1, 3,7$  Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,27 (s, 1H), 2,13 (t,  $J = 2,6$  Hz, 6H), 2,10 (s, 1H), 1,27-1,16 (m, 3H); Masa (M + H): 419, pureza mediante HPLC: 98,08%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 con 3, 4-difluorofeniltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

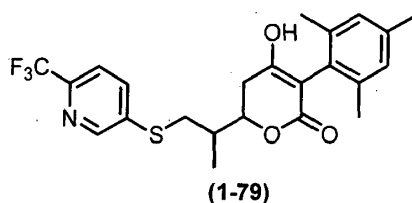
<Compuesto de fórmula 1-36>



Sólido de color pardo (69%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,25-7,03 (m, 3H), 6,95 (d,  $J = 3,1$  Hz, 2H), 5,75 (s ancho, 1H), 4,72 (dt,  $J = 13,2, 3,4$  Hz, 1H), 4,52-4,31 (m, 1H), 3,44-3,17 (m, 1H), 2,97-2,67 (m, 3H), 2,63-2,36 (m, 1H), 2,32-1,94 (m, 8H), 1,31-0,95 (m, 3H); Masa (M + H): 419, pureza mediante HPLC: 98,82%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 6-(trifluorometil)piridin-3-iltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-79>

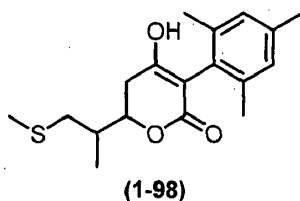


sólido de color blanco (50%). RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8,63 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 7,83 (dd,  $J = 150,7, 8,2$  Hz, 1H), 7,60 (d,  $J = 8,4$  Hz, 1H), 6,96 (d,  $J = 4,1$  Hz, 2H), 5,59 (s, 1H), 4,74-4,41 (m, 1H), 3,61-3,34 (m, 1H), 3,10-2,92 (m, 1H), 2,92-2,67 (m, 2H), 2,65-2,31 (m, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,17-2,06 (m, 6H), 1,30-1,16 (m, 3H); Masa (M + H): 452, pureza mediante HPLC: 97,15%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando metiltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-98>



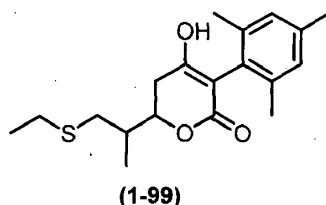


5 Sólido de color pardo (33%). RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,96 (d,  $J = 3,7$  Hz, 2H), 4,78-4,47 (m, 1H), 2,93-2,69 (m, 2H), 2,61-2,38 (m, 2H), 2,29 (m, 4H), 2,17 (m, 10H), 1,17 (dd,  $J = 15,2, 6,9$  Hz, 3H); Masa (M + H): 321, pureza mediante HPLC: 95,55%.

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando etiltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

10

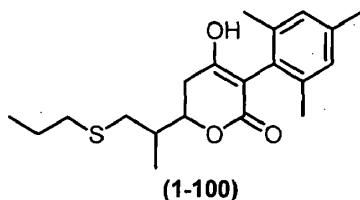
<Compuesto de fórmula 1-99>



15 sólido de color blanquecino (28%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,96 (d,  $J = 3,9$  Hz, 2H), 5,59 (s, 1H), 4,72-4,53 (m, 1H), 2,94-2,69 (m, 2H), 2,57 (ddt,  $J = 10,8, 7,2, 3,1$  Hz, 3H), 2,51-2,37 (m, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,14 (d,  $J = 6,1$  Hz, 7H), 1,28 (td,  $J = 7,3, 1,2$  Hz, 3H), 1,17 (dd,  $J = 16,8, 6,8$  Hz, 3H); Masa (M + H): 335, pureza mediante HPLC: 95,08%.

20 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando propiltiofenol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

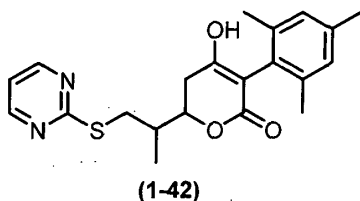
<Compuesto de fórmula 1-100>



25 sólido de color blanquecino (22%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,96 (d,  $J = 3,8$  Hz, 2H), 5,52 (s, 1H), 4,78-4,47 (m, 1H), 2,93-2,69 (m, 2H), 2,64-2,39 (m, 5H), 2,29 (s, 3H), 2,14 (re,  $J = 6,1$  Hz, 6H), 1,63 (q,  $J = 7,3$  Hz, 2H), 1,17 (dd,  $J = 16,4, 6,9$  Hz, 3H), 1,00 (t,  $J = 70,3$  Hz, 3H); Masa (M-H): 347, pureza mediante HPLC: 95,38%.

30 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando pirimidin-2-iltiol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-42>

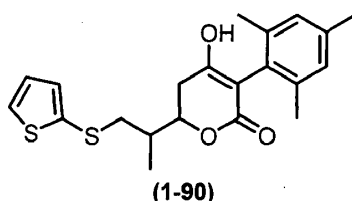


35 sólido de color blanquecino (33%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8,52 (dd,  $J = 4,8, 1,2$  Hz, 2H), 7,02-6,92 (m, 3H), 5,53 (s, 1H), 4,77-4,61 (d,  $J = 12,6$  Hz, 1H), 3,65-3,39 (m, 1H), 3,21 (dd,  $J = 21,8, 13,8, 7,4$  Hz, 1H), 2,99-2,84 (m,

1H), 2,64-2,39 (m, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,14 (d,  $J = 2,0$  Hz, 6H), 1,24 (dd,  $J = 14,6, 6,8$  Hz, 3H); Masa (M + H): 385, pureza mediante HPLC: 95,06%.

5 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando tiofen-2-iltiol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

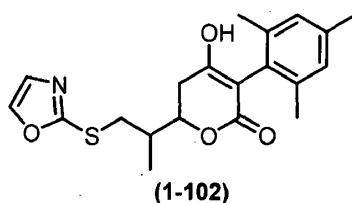
<Compuesto de fórmula 1-90>



10 Sólido de color pardo (55%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,34 (s, 1H), 7,15 (d,  $J = 4,3$  Hz, 1H), 6,96 (s, 3H), 5,52 (s, 1H), 4,81 - 4,47 (m, 1H), 3,25 - 3,07 (m, 1H), 2,92 - 2,66 (m, 2H), 2,42 (t,  $J = 19,0$  Hz, 1H), 2,28 (s, 3H), 2,13 (dd,  $J = 10,4, 4,4$  Hz, 7H), 1,20 (dd,  $J = 7,1, 3,0$  Hz, 3H); Masa (M + H): 389, pureza mediante HPLC: 93,57%.

15 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando oxazol-2-iltiol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

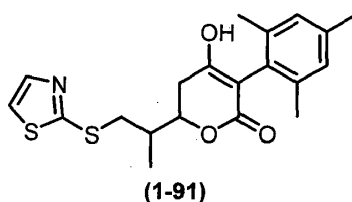
<Compuesto de fórmula 1-102>



20 sólido de color blanquecino (50%): RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,69-7,65 (m, 1H), 7,09 (s, 1H), 6,96 (s, 2H), 5,59 (s, 1H), 4,84 - 4,48 (m, 1H), 3,65 - 3,40 (m, 1H), 3,23 (dt,  $J = 13,5, 8,0$  Hz, 1H), 2,88 (td,  $J = 16, 4,12,8$  Hz, 2H), 2,61 - 2,32 (m, 3H), 2,29 (s, 6H), 2,18 - 2,10 (m, 1H), 1,22 (dd,  $J = 13,6, 7,0$  Hz, 3H); Masa (M + H): 374, pureza mediante HPLC: 98,10%.

25 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando tiazol-2-iltiol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

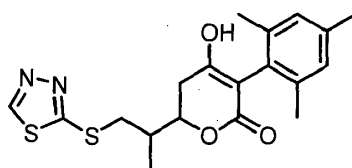
30 <Compuesto de fórmula 1-91>



35 sólido de color blanquecino (23%): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,65 (d,  $J = 3,4$  Hz, 1H), 7,22 (dd,  $J = 3,4, 1,9$  Hz, 1H), 6,95 (d,  $J = 3,7$  Hz, 2H), 5,62 (d,  $J = 24,8$  Hz, 1H), 4,83-4,50 (m, 1H), 3,66-3,51 (m, 1H), 3,27 (ddd,  $J = 19,6, 13,5, 7,3$  Hz, 1H), 2,87 (ddd,  $J = 20,1, 17,2, 13,0$  Hz, 1H), 2,50 - 2,32 (m, 1H), 2,28 (s, 3H), 2,25 (d,  $J = 3,7$  Hz, 1H), 2,18 - 2,11 (m, 6H), 1,23 (dd,  $J = 13,6, 6,9$  Hz, 3H); Masa (M + H): 390, pureza mediante HPLC: 99,13%.

40 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando 1,3,4-tiadiazol-2-iltiol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-103>

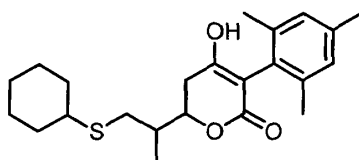


(1-103)

5 sólido de color blanco (38%) RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  9,00 (dd,  $J = 3,4, 1,5$  Hz, 1H), 6,96 (s, 2H), 5,73 (d,  $J = 11,1$  Hz, 1H), 4,80 (d,  $J = 12,5$  Hz, 1H), 3,75 (ddd,  $J = 63,5, 13,4, 5,4$  Hz, 1H), 3,41 (ddd,  $J = 28,3, 13,4, 7,5$  Hz, 1H), 3,07-2,80 (m, 1H), 2,68-2,37 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,20 - 2,08 (m, 6H), 1,32 - 1,20 (m, 3H); Masa (M + H): 391, pureza mediante HPLC: 95,43%.

10 El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando ciclohexiltiol en lugar de un compuesto de fórmula (20-15).

<Compuesto de fórmula 1-105>

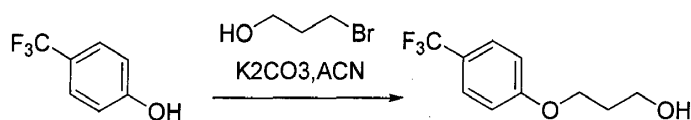


(1-105)

15 sólido de color blanco (22%): RMN  $H^1$  (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  6,96 (d,  $J = 50,5$  Hz, 2H), 5,54 (s, 1H), 4,76-4,48 (m, 1H), 2,92-2,80 (m, 2H), 2,61 (tdd,  $J = 12,7, 7,7, 5,2$  Hz, 2H), 2,47 (ddd,  $J = 320,0, 17,1, 3,7$  Hz, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,15 (d,  $J = 8,0$  Hz, 7H), 1,99 (dd,  $J = 8,4, 5,2$  Hz, 3H), 1,77 (s, 2H), 1,62 (d,  $J = 10,3$  Hz, 1H), 1,40-1,23 (m, 5H), 1,19 (d,  $J = 6,8$  Hz, 2H); Masa (M + H): 389, pureza mediante HPLC: 95,87%.

20 Ejemplo de Preparación 1-4 Preparación de un compuesto de fórmula (1-106)

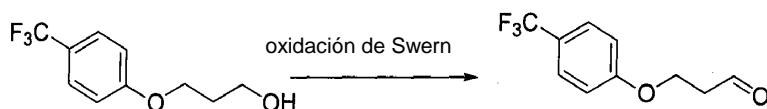
<Preparación de un compuesto de 3-(4-(trifluorometil)fenoxi)propan-1-ol>



25 4-(trifluorometil)fenol

30 A una solución de 4-(trifluorometil)fenol (3 g, 18,50 mmoles) en ACN (50 ml) se le añadió  $K_2CO_3$  (70,6 g, 55,50 mmoles), seguido de la adición de 3-bromofenol (3 g, 22,20 mmoles) y se agitó la reacción a RT durante 16 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $Na_2SO_4$  anhidro, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 20%/éter de pet. para proporcionar 3-(4-(trifluorometil)fenoxi)propan-1-ol en forma de una masa oleosa (3,0 g, 75 %); RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,54 (d,  $J = 8,4$  Hz, 2H), 6,97 (d,  $J = 8,4$  Hz, 2H), 4,17 (t,  $J = 6,0$  Hz, 2H), 3,87 (p,  $J = 6,7, 6,2$  Hz, 2H), 2,15-2,00 (m, 2H).

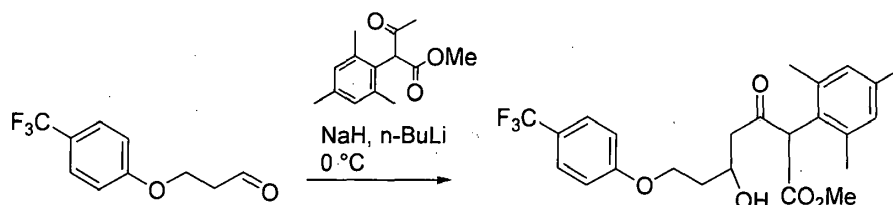
35 <Preparación de un compuesto de 3-(4-(trifluorometil)fenoxi)propanal>



40 A una solución de dimetilsulfóxido (2,8 ml, 40,53 mmoles) en diclorometano (30 ml) se le añadió cloruro de oxalilo (1,75 ml, 20,40 mmoles) a  $-78^\circ C$  y la mezcla de reacción se agitó durante 30 min., a la misma temperatura se añadió la solución de 3-(4-(trifluorometil)fenoxi)propan-1-ol (3 g, 13,51 mmoles) en diclorometano seco (30 ml) a la mezcla

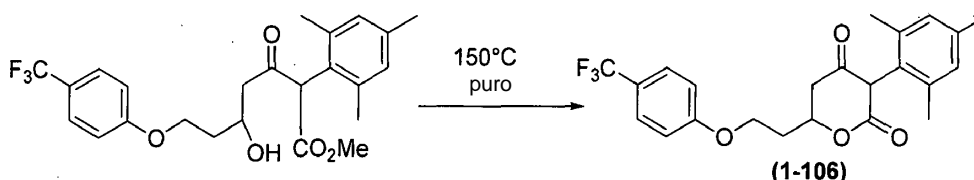
de reacción y se agitó durante 30 min. Seguido de la adición de trietilamina (7,5 ml, 53,46 mmoles) a  $-78^{\circ}\text{C}$  y se agitó a RT durante 1 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua, se extrajo con DCM (2 veces), la capa de DCM se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 5%/éter de pet. para proporcionar 3-(4-(trifluorometil)fenoxi)propanal en forma de una masa oleosa (1,5 g, razonablemente pura); RMN  $^1\text{H}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9,88 (t,  $J = 1,4$  Hz, 1H), 7,63-7,44 (m, 2H), 6,93-6,87 (m, 2H), 4,35 (t,  $J = 6,1$  Hz, 2H), 2,95 (td,  $J = 6,1, 1,4$  Hz, 2H).

<Preparación de un compuesto de 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-7-(4-(trifluorometil)fenoxi)heptanoato de metilo>



A una suspensión de NaH (256 mg, 6,41 mmoles) en THF (5 ml) se le añadió la solución de 2-mesitil-3-oxobutanoato de metilo (500 mg, 2,13 mmoles) en THF (5 ml) a  $0^{\circ}\text{C}$  y se agitó durante 30 min. y se enfrió a  $-40^{\circ}\text{C}$  seguido de la adición de n-BuLi (5,3 ml, 8,54 mmoles) y se agitó durante 30 min. seguido de la adición de una solución de 3-(4-(trifluorometil)fenoxi)propanal (1,5 g, 6,41 mmoles) en THF (2 ml) a  $-40^{\circ}\text{C}$  y se agitó durante 30 min. La reacción no se completó, por lo tanto, la MR se sofocó con una solución saturada de cloruro de amonio a  $0^{\circ}\text{C}$ , se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 10%/éter de pet. para proporcionar 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-7-(4-(trifluorometil)fenoxi)heptanoato de metilo en forma de una masa oleosa (260 mg, LCMS pureza: 45%); RMN  $^1\text{H}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  13,35 (d,  $J = 1,1$  Hz, 1H), 7,53 (td,  $J = 6,8, 2,8$  Hz, 2H), 7,00-6,76 (m, 4H), 4,37 (dd,  $J = 7,2, 1,0$  Hz, 2H), 3,69 (d,  $J = 1,1$  Hz, 3H), 2,28 (d,  $J = 5,2$  Hz, 3H), 2,24-2,14 (m, 2H), 2,20-2,14 (m, 2H), 2,08 (d,  $J = 9,7$  Hz, 6H), 1,86-1,82 (m, 2H); Masa (M + H): 451; Pureza mediante LCMS: 45,56%; Masa (M-H): 451, Pureza mediante LCMS: 45,56%.

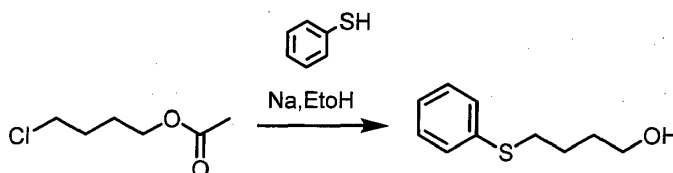
<Preparación de un compuesto de fórmula 1-106>



El 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-7-(4-(trifluorometil)fenoxi)heptanoato de metilo (260 mg, 0,57 mmoles) se calentó a  $150^{\circ}\text{C}$  durante 3 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 7%/éter de pet. para proporcionar 3-mesitil-6-(2-(4-(trifluorometil)fenoxi)etil)dihidro-2H-piran-2,4(3H)-diona (1-106) en forma de un sólido de color blanco (75 mg; 15,3%; rendimiento total para las etapas 3 y 4); RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,56 (d,  $J = 8,4$  Hz, 2H), 7,04-6,92 (m, 4H), 6,4-5,0 (s ancho, 1H), 4,84 (d,  $J = 4,1$  Hz, 1H), 4,29 (dd,  $J = 23,4, 5,0$  Hz, 2H), 2,84 (dd,  $J = 17,2, 12,0$  Hz, 1H), 2,65 (dd,  $J = 17,3, 4,0$  Hz, 1H), 2,29 (s, 5H), 2,14 (d,  $J = 3,7$  Hz, 6H); Masa (M + H): 421, pureza mediante HPLC: 95,06%.

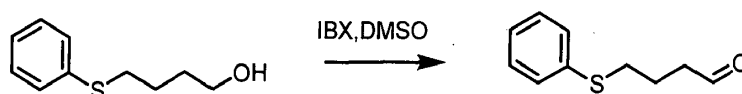
Ejemplo de Preparación 1-5 Preparación de un compuesto de fórmula (1-107)

<Preparación de un compuesto de 4-(feniltio)butan-1-ol>



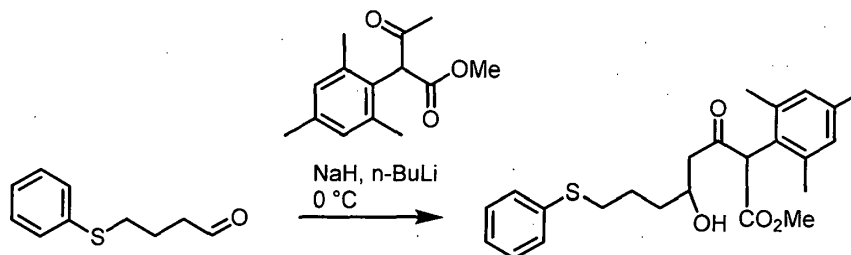
A una suspensión de etóxido de sodio (4 g, 59,18 mmoles) en EtOH (50 ml) se le añadió tiofenol (5 g, 45,45 mmoles) a 0°C, seguido de la adición gota a gota de acetato de 4-clorobutilo (7 g, 45,45 mmoles) durante un período de 20 min. y se agitó la misma temperatura durante 10 min. y se calentó a reflujo durante 6 h. La MR enfrió la reacción a RT, se añadieron lentejas de KOH (2,6 g, 45,45 mmoles), se calentó a reflujo durante 4 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 60-120), eluyendo con EtOAc al 8%/éter de pet. para proporcionar 4-(feniltio)butan-1-ol en forma de una masa oleosa (6 g, 72%); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,33 (dd, *J* = 8,2, 1,6 Hz, 2H), 7,30-7,23 (m, 2H), 7,20-7,14 (m, 1H), 3,65 (td, *J* = 5,0, 4,1, 3,0 Hz, 2H), 2,96 (t, *J* = 6,9 Hz, 2H), 1,78-1,65 (m, 4H); Masa (M + H): 183, Pureza mediante LCMS: 99,83%.

<Preparación de un compuesto de 4-(feniltio)butanal>



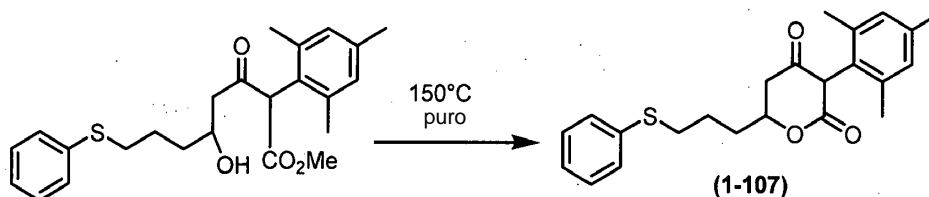
A una solución de 4-(feniltio)butan-1-ol (4 g, 21,9 mmoles) en DMSO (20 ml) se le añadió ácido 2-yodoxibenzoico (9,32 g, 281 mmoles) a RT y se agitó a RT durante 8 h. Después de la finalización, la MR se diluyó con EtOAc, se filtró para eliminar los sólidos, el producto filtrado se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 5%/éter de pet. para proporcionar 4-(feniltio)butanal en forma de un líquido incoloro (2 g, 52%); RMN H<sup>1</sup> (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 9,77 (dt, *J* = 7,2, 1,2 Hz, 1H), 7,37-7,32 (m, 2H), 7,32-7,24 (m, 2H), 7,23-7,14 (m, 1H), 2,97 (dd, *J* = 7,7, 6,4 Hz, 2H), 2,69-2,57 (m, 2H), 1,96 (p, *J* = 7,1 Hz, 2H).

<Preparación de un compuesto de 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-8-(feniltio)octanoato de metilo>



A una suspensión de NaH (301 mg, 7,69 mmoles) en THF (10 ml) se le añadió la solución de 2-mesitil-3-oxobutanoato de metilo (600 mg, 2,56 mmoles) en THF (10 ml) a 0°C y se agitó durante 30 min. y se enfrió a -40°C seguido de la adición de n-BuLi (6,41 ml, 10,25 mmoles) y se agitó durante 30 min. seguido de la adición de una solución de 4-(feniltio)butanal (1,38 g, 7,69 mmoles) en THF (3 ml) a -40°C y se agitó durante 30 min. La reacción no se completó, por lo tanto, la MR se sofocó con una solución saturada de cloruro de amonio a 0°C, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> *anhidro*, se filtró y se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 25%/éter de pet. para proporcionar 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-8-(feniltio)octanoato de metilo en forma de una masa oleosa (1,1 g; bruto, LCMS pureza: 43%).

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-107>

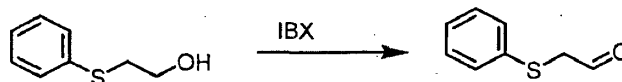


El 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-8-(feniltio)octanoato de metilo (1,1 g, 2,65 mmoles) se calentó a 150°C durante 3 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se

lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 7%/éter de pet. para proporcionar 3-mesitil-6-(3-(feniltio)propil)dihidro-2H-piran-2,4(3H)-diona (**1-107**) en forma de un sólido de color blanquecino (150 mg; 16,3%; rendimiento total de las etapas 3 y 4); RMN  $^1\text{H}$  (400 MHz, DMSO)  $\delta$  10,62 (s, 1H), 7,40-7,12 (m, 5H), 6,80 (d,  $J = 2,8$  Hz, 2H), 4,50 (dt,  $J = 7,4, 3,7$  Hz, 1H), 3,09-2,95 (m, 2H), 2,70-2,53 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,00 (d,  $J = 8,7$  Hz, 6H), 1,90-1,65 (m, 4H); Masa (M-H): 381, Pureza mediante LCMS: 97,79%.

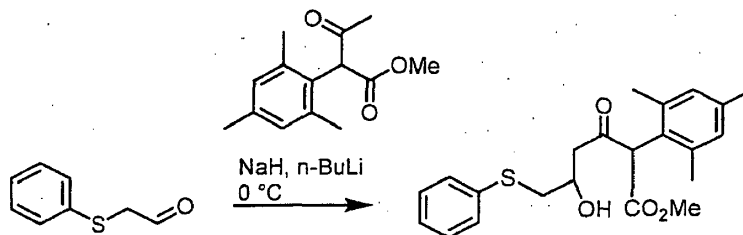
Ejemplo de Preparación 1-6 Preparación de un compuesto de fórmula (1-108)

<Preparación de un compuesto de 2-(feniltio) acetaldehído>



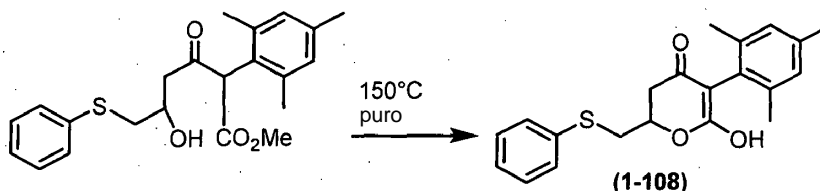
A una solución de 2-(feniltio)etanol (5 g, 32,46 mmoles) en DMSO (25 ml) se le añadió ácido 2-yodooxibenzoico (13,68 g, 48,70 mmoles) a RT y se agitó a RT durante 8 h. Después de la finalización, la MR se diluyó con EtOAc, se filtró para eliminar los sólidos, el producto filtrado se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 5%/éter de pet. para proporcionar 2-(feniltio)acetaldehído en forma de una masa oleosa (1,8 g rendimiento: 42%); RMN  $^1\text{H}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9,56 (t,  $J = 3,2$  Hz, 1H), 7,40-7,23 (m, 5H), 3,60 (d,  $J = 30,2$  Hz, 2H).

<Preparación de un compuesto de 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-6-(feniltio)hexanoato de metilo>



A una suspensión de NaH (358 mg, 8,97 mmoles) en THF (15 ml) se le añadió la solución de 2-mesitil-3-oxobutanoato de metilo (700 mg, 2,99 mmoles) en THF (25 ml) a 0°C y se agitó durante 30 min. y se enfrió a -40°C seguido de la adición de n-BuLi (7,4 ml, 11,96 mmoles) y se agitó durante 30 min. seguido de la adición de una solución de 2-(feniltio)acetaldehído (1,36 mg, 8,97 mmoles) a -40°C y se agitó durante 30 min. La reacción no se completó, por lo tanto, la MR se sofocó con una solución saturada de cloruro de amonio a 0°C, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 6%/éter de pet. para proporcionar 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-6-(feniltio)hexanoato de metilo en forma de una masa oleosa (262 mg, 44%); RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  13,24 (s, 1H), 7,29 a 7,24 (m, 5H), 6,88 (d,  $J = 6,5$  Hz, 2H), 4,03 (s, 1H), 3,68 (d,  $J = 1,2$  Hz, 3H), 2,96 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1H), 2,84 (dd,  $J = 13,7, 7,7$  Hz, 1H), 2,76 (d,  $J = 3,5$  Hz, 1H), 2,30 (s, 3H), 2,26-2,20 (m, 2H), 2,06 (s, 3H), 2,04 (d,  $J = 14,3$  Hz, 3H); Masa (M + H): 387, Pureza mediante LCMS: 75,83%.

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-108>

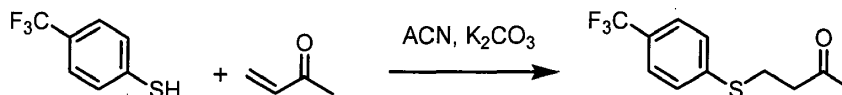


El 5-hidroxi-2-mesitil-3-oxo-6-(feniltio)hexanoato de metilo (260 mg, 0,67 mmoles) se calentó a 150°C durante 3 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice

(malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 6%/éter de pet. para proporcionar 6-hidroxi-5-mesitil-2-(feniltiometil) 2H-piran-4 (3H)-ona (**1-108**) en forma de un sólido de color blanco (80 mg, 33%); RMN  $H^1$  (400 MHz, DMSO)  $\delta$  10,79 (s, 1H), 7,49-7,15 (m, 5H), 6,80 (d,  $J = 5,2$  Hz, 2H), 4,62 (dd,  $J = 10,7, 5,1$  Hz, 1H), 3,41 (t,  $J = 5,3$  Hz, 2H), 2,89-2,69 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,99 (d,  $J = 3,0$  Hz, 6H); Masa (M + H): 354,9; Pureza HPLC: 95,00%.

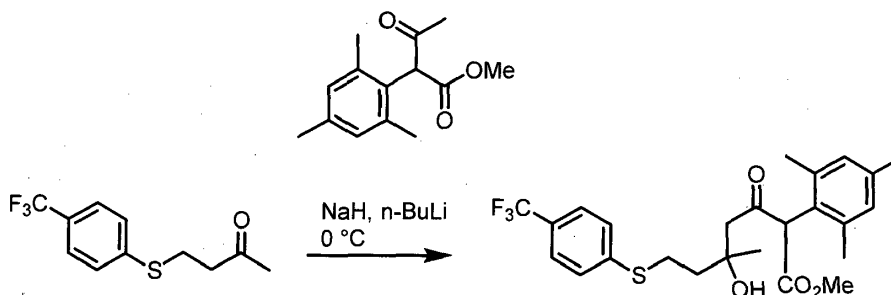
Ejemplo de Preparación 1-7 Preparación de un compuesto de fórmula (1-109)

<Preparación de un compuesto de 4-(4-(feniltiotrifluorometil))butan-2-ona>



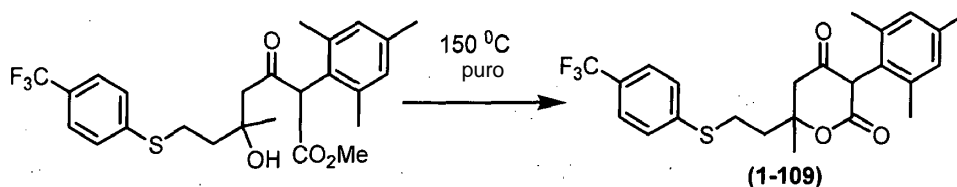
A una solución de 4-(trifluorometil)benzenotiol (3 g, 16,83 mmoles) en ACN (50 ml) se le añadió  $K_2CO_3$  (60,97 g, 50,51 mmoles), seguido de la adición de metil vinil cetona (1,68 ml, 20,20 mmoles) y la reacción se agitó a RT durante 16 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 5%/éter de pet. para proporcionar 4-(4-(trifluorometil)feniltio)butan-2-ona en forma de sólido de color blanco (3 g, 74%); RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  7,53 (d,  $J = 8,1$  Hz, 2H), 7,36 (d,  $J = 8,1$  Hz, 2H), 3,20 (t,  $J = 7,2$  Hz, 2H), 2,81 (t,  $J = 7,2$  Hz, 2H), 2,18 (s, 3H); Masa (M + H): 249; Pureza mediante LCMS: 98,75%.

<Preparación de un compuesto de Metil5-hidroxi-2-mesitil-5-metil-3-oxo-7-(4-(trifluorometil)feniltio)heptanoato>



A una suspensión de NaH (306 mg, 7,69 mmoles) en THF (15 ml) se le añadió la solución de 2-mesitil-3-oxobutanoato de metilo (600 mg, 2,46 mmoles) en THF (15 ml) a 0°C y se agitó durante 30 min. y se enfrió a -40°C seguido de la adición de n-BuLi (6 ml, 10,15 mmoles) y se agitó durante 30 min. seguido de la adición de una solución de 4-(4-(feniltio trifluorometil))butan-2-ona (1,8 g, 7,69 mmoles) en THF (2 ml) a -40°C y se agitó durante 30 min. Después de la finalización, la MR se sofocó con una solución saturada de cloruro de amonio a 0°C, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el producto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 25%/éter de pet. para proporcionar 5-hidroxi-2-mesitil-5-metil-3-oxo-7-(4-( trifluorometil)feniltio)heptanoato de metilo (800 mg; LCMS pureza: 30%).

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-109>

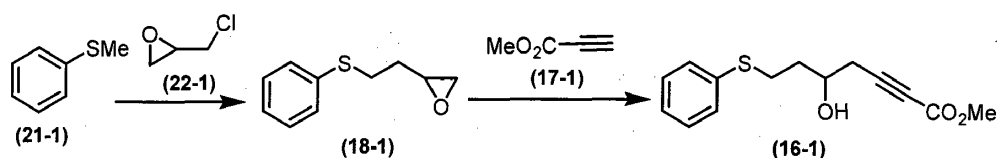


El metil 5-hidroxi-2-mesitil-5-metil-3-oxo-7-(4-(trifluorometil)feniltio)heptanoato de metilo (900 mg, bruto) se calentó a 150°C durante 3 h. Después de la finalización, la MR se vertió en agua con hielo, se extrajo con EtOAc (2 veces), la capa de EtOAc se lavó con agua, salmuera, se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro*, se filtró y el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener el compuesto bruto. El compuesto bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (malla 100-200), eluyendo con EtOAc al 7%/éter de pet. para proporcionar 3-mesitil-6-metil-

6-(2-(4-(trifluorometil)feniltio)etil)dihidro-2H-piran-2,4(3H)-diona (1-109) en forma de un sólido de color blanco (110 mg, 10%, rendimiento total en las etapas 2 y 3); RMN  $H^1$  (300 MHz, DMSO)  $\delta$  10,64 (s, 1H), 7,64 (d,  $J = 8,1$  Hz, 2H), 7,52 (d,  $J = 8,0$  Hz, 2H), 6,79 (d,  $J = 7,5$  Hz, 2H), 3,19 (t,  $J = 7,9$  Hz, 2H), 2,89 (d,  $J = 170,3$  Hz, 1H), 2,66 (d,  $J = 170,5$  Hz, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,10 (s, 2H), 2,01 (s, 3H), 1,89 (s, 3H), 1,53 (s, 3H); Masa (M + H): 451, pureza mediante HPLC: 97,27%.

Ejemplo de preparación 4 Preparación de un compuesto de fórmula (1-4)

<Preparación de un compuesto de fórmula 16-1>



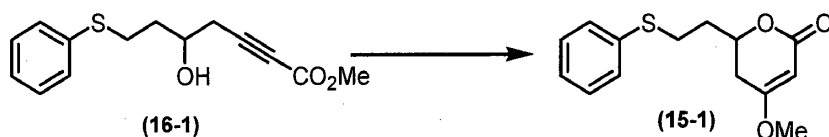
A RT en atmósfera de nitrógeno, se diluyeron 6,2 ml de un compuesto de fórmula (21-1) con 50 ml de tetrahidrofurano deshidratado y a la solución resultante se le añadieron 600 mg de trietilendiamina. Después, la mezcla disolvente resultante se enfrió a 0°C y se añadieron a la misma 32 ml de n-butil-litio (solución 1,6 M en hexano; 53 mmoles, 1,0 eq.) y la mezcla resultante se agitó durante aproximadamente 2 horas mientras que la temperatura de reacción se elevaba a RT. Después, la mezcla disolvente resultante se enfrió a -78°C y a esto se le añadieron a continuación 8,3 ml de un compuesto de fórmula (22-1), y la solución de reacción resultante se agitó durante aproximadamente 2 horas mientras que la temperatura de reacción se elevaba a RT lentamente. A la solución de reacción resultante se añadieron 25 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio y la capa acuosa se extrajo con cloroformo. La capa de cloroformo obtenida se lavó con solución salina saturada y se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro* y se filtró, y el producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida y se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:4) para proporcionar 3,27 g de un compuesto de fórmula (18-1).

Sucesivamente, a RT en atmósfera de nitrógeno, se diluyeron 2,4 ml de un compuesto de fórmula (17-1) con 35 ml de tetrahidrofurano deshidratado y la solución resultante se enfrió a -78°C y después se añadió a esto n-butil litio 16,3 ml (solución 1,6 M en hexano), y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 10 minutos. A la solución de reacción resultante se le añadieron a continuación a la misma temperatura 3,6 ml de complejo de trifluoruro de boro-éter dietílico, y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 10 minutos. Se añadieron después a la solución resultante a la misma temperatura 3,27 g de una solución de un compuesto de fórmula (18-1) en 10 ml de tetrahidrofurano deshidratado gota a gota y la mezcla resultante se agitó durante aproximadamente 30 minutos. A la solución de reacción resultante se le añadieron 30 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. La capa de acetato de etilo resultante se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro* y se filtró, y el producto filtrado resultante se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:3) para proporcionar un compuesto de fórmula (16-1) 2,67 g (rendimiento 56%).

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,35-7,32 (2H, m), 7,30-7,25 (2H, m), 7,20-7,15 (1H, m), 4,04 (1H, dd), 3,75 (3H, s), 3,13-2,98 (2H, m), 2,86-2,78 (1H, m), 2,52 (2H, dd), 1,89-1,84 (2H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 15-1>



A RT, se disolvieron 2,67 g del compuesto de fórmula (16-1) en 60 ml de metanol. La solución resultante se enfrió a 0°C y a esto se añadieron 0,65 g de una solución de metóxido de sodio al 28%, y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 1 hora y después se elevó a RT, y se agitó durante aproximadamente 12 horas. A la solución de reacción resultante se añadió después solución acuosa saturada de cloruro de amonio, y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo y la capa de acetato de etilo se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro* y se concentró a presión reducida, y se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1: 2) para proporcionar un compuesto de fórmula (15-1) 2 g (rendimiento 75%).

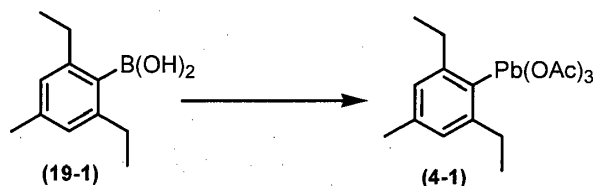
RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,35-7,27 (4H, m), 7,21-7,17 (1H, m), 5,13 (1H, s), 4,60-4,53 (1H, m), 3,73 (3H, s), 3,20-3,14 (1H, m), 3,9-3,2



(1H, m), 2,53-2,45 (1H, m), 2,34-2,28 (1H, m), 2,16-2,7 (1H, m), 1,94-1,85 (1H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 4-1>



5

A RT en atmósfera de nitrógeno, 26,5 g de tetraacetato de plomo, 0,83 g de acetato de mercurio y 10 g de un compuesto de fórmula (19-1) se disolvieron en 110 ml de cloroformo. La solución resultante se agitó a RT en una atmósfera de nitrógeno durante 15 minutos. La solución resultante se agitó a continuación a 40°C en atmósfera de nitrógeno durante 4 horas. La solución de reacción se enfrió a RT y después se filtró a través de Celite (marca registrada) y el producto filtrado se concentró a presión reducida para proporcionar un aceite de color amarillo. Al aceite obtenido se le añadió hexano, y la mezcla resultante se concentró a presión reducida para proporcionar un sólido de color amarillo. A RT en atmósfera de nitrógeno, se disolvieron en cloroformo 260 ml del sólido obtenido. A la solución resultante se le añadieron 86,2 g de carbonato de potasio y la mezcla resultante se agitó durante 10 minutos. Después, la solución de reacción se filtró a través de Celite (marca registrada) y el producto filtrado se concentró a presión reducida para proporcionar 21 g de un compuesto de fórmula (4-1).

10

15

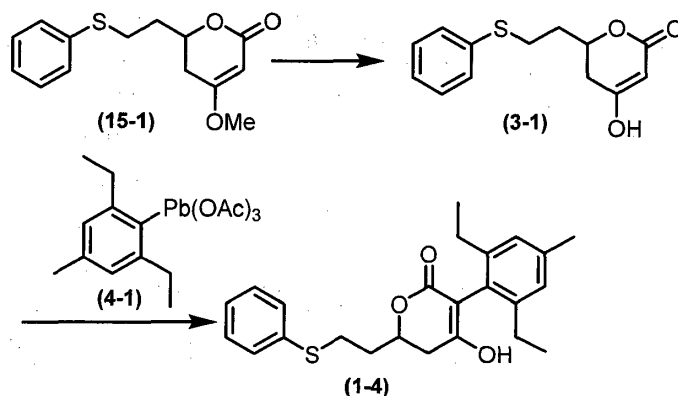
Asimismo, se puede preparar un compuesto de fórmula (19-1) de acuerdo con un método descrito en el documento WO 2010/113986 o un método similar al mismo.

20

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,05 (2H, s), 2,90 (4H, m), 2,35 (3H, s), 2,06 (9H, s), 1,33-1,27 (6H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-4>



25

A RT, se disolvieron 1,17 g del compuesto de fórmula (15-1) en 15 ml de éter dietílico. A la solución resultante se le añadieron a RT 0,6 ml de ácido clorhídrico concentrado, y la mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 12 horas. La solución de reacción resultante se concentró a presión reducida y se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (3:1) para proporcionar 700 mg de producto bruto de un compuesto de fórmula (3-1).

30

Sucesivamente, a RT en atmósfera de nitrógeno, se disolvieron 430 mg del compuesto de fórmula (3-1) y 1,05 g de dimetilaminopiridina en una mezcla disolvente de 4,8 ml de cloroformo y 1,2 ml de tolueno. La solución resultante se agitó a RT en una atmósfera de nitrógeno durante 15 minutos. A la solución resultante se le añadió en atmósfera de nitrógeno 1,0 g del compuesto de fórmula (4-1). En atmósfera de nitrógeno, la mezcla resultante se agitó a 80°C durante 1 hora. La solución de reacción resultante se enfrió a RT y se ajustó con ácido clorhídrico 2 N para llevar el pH a 1 y se filtró a través de Celite (marca registrada), y el producto filtrado se extrajo con cloroformo. La capa de cloroformo obtenida se lavó con agua y se secó sobre  $Na_2SO_4$  anhidro y se filtró. El producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida para proporcionar aceite amarillo. El aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:4) para proporcionar 71 mg de un compuesto de fórmula (1-4).

35

40

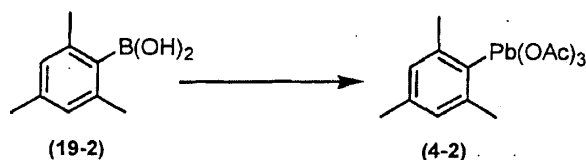
RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,39-7,19 (5H, m), 7,00 (1H, s), 6,98 (1H, s), 5,65 (1H, s), 4,75-4,68 (1H, m), 3,26-3,10 (2H, m), 2,75-1,96

(11H, m), 1,14-1,7 (6H, m)

Ejemplo de preparación 1-4: Preparación de un compuesto de fórmula (1-5)

5 <Preparación de un compuesto de fórmula 4-2>

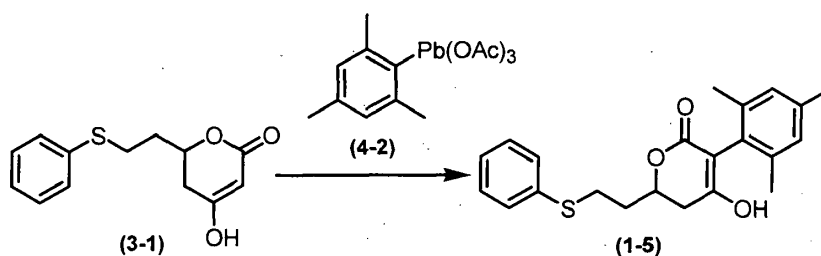


10 A RT en atmósfera de nitrógeno, se disolvieron 6,2 g de tetraacetato de plomo, 194 mg de acetato de mercurio y 2 g de un compuesto de fórmula (19-2) en 25 ml de cloroformo. La solución resultante se agitó a RT en una atmósfera de nitrógeno durante 15 minutos. La solución de reacción se agitó a continuación a 40°C en atmósfera de nitrógeno durante 4 horas. La solución de reacción se enfrió a RT y se filtró a través de Celite (marca registrada), y después el producto filtrado se concentró a presión reducida para proporcionar un aceite de color amarillo. Al aceite obtenido se le añadió hexano y la mezcla resultante se concentró a presión reducida para proporcionar un sólido de color

15 amarillo. A RT en atmósfera de nitrógeno, el sólido obtenido se disolvió en cloroformo 50 ml. A la solución resultante se le añadieron 20 g de carbonato de potasio y la mezcla resultante se agitó durante 10 minutos. Después, la solución de reacción se filtró a través de Celite (marca registrada). El producto filtrado resultante se concentró a presión reducida para proporcionar 4 g de un compuesto de fórmula (4-2).

20 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )  
 $\delta$  ppm: 6,99 (2H, s), 2,57 (6H, s), 2,30 (3H, s), 2,06 (9H, s)

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-5>



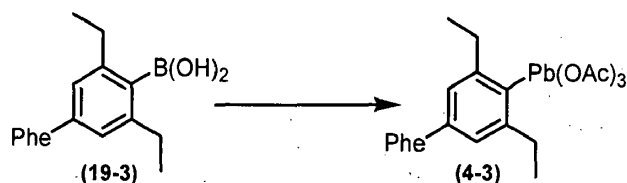
25 A RT en atmósfera de nitrógeno, se disolvieron 250 mg de un compuesto de fórmula (3-1) y 610 mg de dimetilaminopiridina en una mezcla disolvente de 2,5 ml de cloroformo y 0,5 ml de tolueno. La solución resultante se agitó a RT en una atmósfera de nitrógeno durante 15 minutos. En atmósfera de nitrógeno, a la solución resultante se le añadieron a continuación 560 mg de un compuesto de fórmula (4-2). En atmósfera de nitrógeno, la mezcla

30 resultante se agitó a 80°C durante 1 hora. La solución de reacción resultante se enfrió a RT y se ajustó con ácido clorhídrico 2 N para llevar el pH a 1 y se filtró a través de Celite (marca registrada) y el producto filtrado se extrajo con cloroformo. La capa de cloroformo resultante se lavó con agua y se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro* y se filtró. El producto filtrado resultante se concentró a presión reducida para proporcionar aceite amarillo. El aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna utilizando ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:4) para proporcionar 155 mg de un compuesto de fórmula (1-5).

35 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )  
 $\delta$  ppm: 7,39-7,18 (5H, m), 6,94 (2H, s), 5,73 (1H, s), 4,75-4,67 (1H, m), 3,25-3,09 (2H, m), 2,73-2,66 (1H, m), 2,55-2,49 (1H, m), 2,28-2,06 (10H, m), 2,04-1,94 (1H, m)

40 Ejemplo de preparación 1-5: Preparación de un compuesto de fórmula (1-6)

<Preparación de un compuesto de fórmula 4-3>



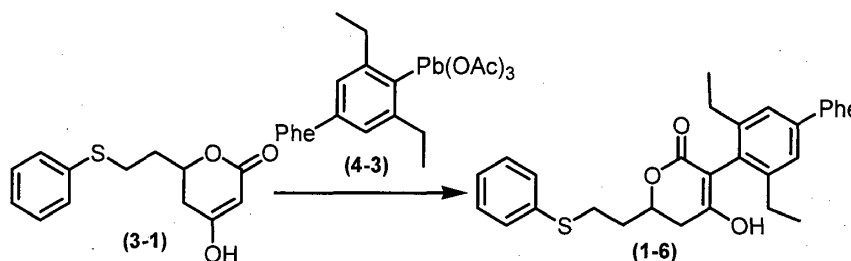
A RT en atmósfera de nitrógeno, se disolvieron 8,4 g de tetraacetato de plomo, 263 mg de acetato de mercurio y un 4,2 g de compuesto de fórmula (19-3) en 35 ml de cloroformo. La solución resultante se agitó a RT en una atmósfera de nitrógeno durante 15 minutos. La solución de reacción se agitó a continuación a 40°C en atmósfera de nitrógeno durante 4 horas. La solución de reacción se enfrió a RT y se filtró a través de Celite (marca registrada), y el producto filtrado resultante se concentró a presión reducida para proporcionar aceite de color amarillo. Al aceite resultante se le añadió hexano y la mezcla resultante se concentró a presión reducida para proporcionar un sólido de color amarillo. A RT en atmósfera de nitrógeno, el sólido obtenido se disolvió en 80 ml de cloroformo. A la solución resultante se añadieron 27,4 g de carbonato de potasio y la mezcla resultante se agitó durante 10 minutos. Después, la solución de reacción se filtró a través de Celite (marca registrada) y el producto filtrado se concentró a presión reducida para proporcionar un compuesto de fórmula (4-3) 6,4 g.

Asimismo, se puede preparar el compuesto de fórmula (19-3) de acuerdo con un método descrito en el documento WO 2010/113986 o un método similar al mismo.

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,60-7,31 (7H, m), 3,06-2,93 (4H, m), 2,07 (9H, s), 1,39-1,32 (6H, m)

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-6>



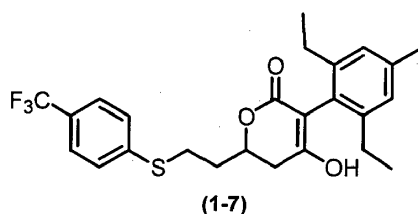
A RT en atmósfera de nitrógeno, se disolvieron 250 mg de un compuesto de fórmula (3-1) y 610 mg dimetilaminopiridina en una mezcla disolvente de 2,5 ml de cloroformo y 0,5 ml de tolueno. La solución resultante se agitó a RT en una atmósfera de nitrógeno durante 15 minutos. A la solución resultante se le añadieron en atmósfera de nitrógeno 653 mg del compuesto de fórmula (4-3). En atmósfera de nitrógeno, la mezcla resultante se agitó a 80°C durante 1 hora. La solución reacción resultante se enfrió a RT y se ajustó con ácido clorhídrico 2 N para llevar el pH a 1 y se filtró a través de Celite (marca registrada) y el producto filtrado se extrajo con cloroformo. La capa de cloroformo obtenida se lavó con agua y se secó sobre  $Na_2SO_4$  y se filtró. El producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida para proporcionar aceite amarillo. El aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1: 4) para proporcionar 149 mg de un compuesto de fórmula (1-6).

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,59 (2H, dd), 7,47-7,19 (10H, m), 5,84 (1H, d), 4,78-4,71 (1H, m), 3,27-3,11 (2H, m), 2,78-2,71 (1H, m), 2,60-2,45 (5H, m), 2,29-2,20 (1H, m), 2,06-1,97 (1H, m), 1,20-1,13 (6H, m)

El presente compuesto se preparó como se muestra a continuación de acuerdo con un procedimiento del Ejemplo de preparación 1-3 utilizando paratriluorometiltioanisol en lugar de tioanisol.

<Compuesto de fórmula 1-7>

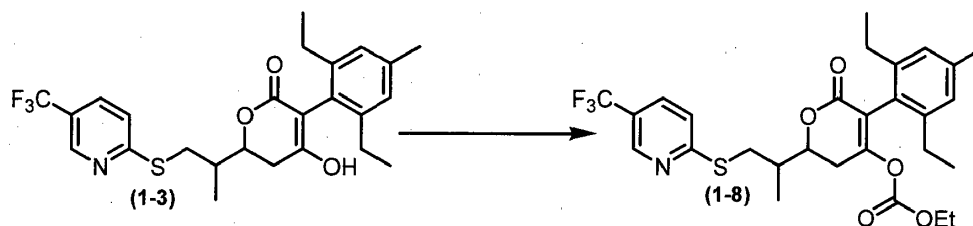


RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )

$\delta$  ppm: 7,54 (2H, d), 7,42 (2H, d), 7,01 (1H, s), 6,99 (1H, s), 5,61 (1H, s), 4,75-4,68 (1H, m), 3,36-3,29 (1H, m), 3,25-3,17 (1H, m), 2,79-2,71 (1H, m), 2,61-2,53 (1H, m), 2,49-2,23 (8H, m), 2,08-1,99 (1H, m), 1,11 (6H, dt)

Ejemplo de preparación 1-6: Preparación de un compuesto de fórmula (1-8)

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-8>



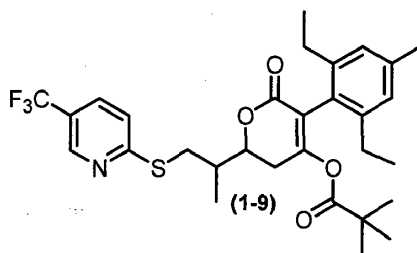
Al 150 mg del compuesto de fórmula (1-3) se le añadieron 0,07 ml de trietilamina y 1 ml de tetrahidrofurano anhidro gota a gota. A la mezcla disolvente resultante se le añadió enfriando con hielo una solución de 0,06 ml de cloroformiato de etilo en 1 ml de tetrahidrofurano anhidro gota a gota. La mezcla resultante se agitó a RT durante 2 horas. A la mezcla resultante se le añadieron 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa de cloroformo obtenida se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro* y se concentró a presión reducida, y se purificó por medio de cromatografía en columna ( $\text{SiO}_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:6) para proporcionar 200 mg de un compuesto de fórmula (1-8).

RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ )

$\delta$  ppm: 8,68-8,66 (1H, m), 7,67 (1H, dd), 7,31 (1H, dd), 6,95 (1H, s), 6,91 (1H, s), 4,83-4,62 (1H, m), 4,19-4,00 (2H, m), 3,71 (0,5H, dd), 3,50 (0,5H, dd), 3,34-3,16 (2H, m), 2,68 (1H, ddd), 2,48-2,32 (8H, m), 1,27-1,20 (6H, m), 1,16-1,5 (6H, m)

El presente compuesto se muestra a continuación se preparó de acuerdo con el ejemplo de preparación 1-6 utilizando cloroformiato de pivaloilo en lugar de cloroformiato de etilo.

<Compuesto de fórmula 1-9>

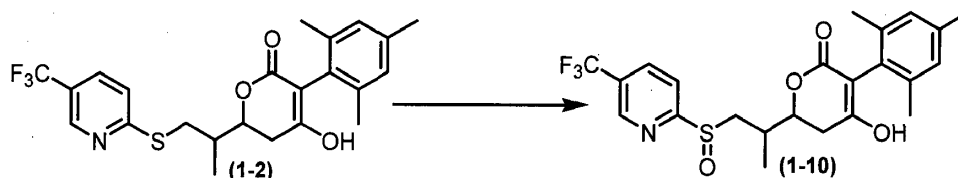


RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ )

$\delta$  ppm: 8,66 (1H, dd), 7,68 (1H, dd), 7,31 (1H, dd), 6,91 (1H, s), 6,87 (1H, s), 4,89-4,64 (1H, m), 3,71 (0,5 H, dd), 3,49 (0,5H, dd), 3,36-3,07 (2H, m), 2,67-2,19 (9H, m), 1,28-1,06 (9H, m), 0,91 (9H, d)

Ejemplo de preparación 1-7: Preparación de un compuesto de fórmula (1-10)

<Preparación de un compuesto de fórmula 1-10>



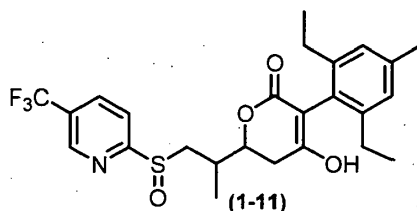
A 250 mg de un compuesto de fórmula (1-2) se le añadieron a RT 5 ml de cloroformo. La mezcla disolvente resultante se enfrió a  $0^\circ\text{C}$  con agitación, y a esto se añadió una solución de 124 mg de ácido metacloroperóxibenzoico disueltos en 5 ml de cloroformo gota a gota y la mezcla resultante se agitó durante aproximadamente 30 minutos y a continuación se elevó a RT, y se agitó a RT durante 3 horas. La solución de reacción se diluyó con cloroformo y se lavó con una solución de sulfito de sodio acuoso al 10%. La capa de cloroformo resultante se lavó con solución salina saturada y se secó sobre  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  *anhidro* y se filtró. El producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida para proporcionar un aceite. El aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna ( $\text{SiO}_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (3:1) para proporcionar 105 mg de un compuesto de fórmula (1-10).

RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ )

$\delta$  ppm: 8,89 (2H, d), 8,22-8,18 (2H, m), 6,93 (2H, s), 4,61-4,55 (1H, m), 3,62-3,51 (0,5H, m), 3,29 (0,5H, dd), 3,11-2,42 (4H, m), 2,27 (3H, s), 2,16-2,09 (6H, m), 1,46-1,21 (3H, m)

5 El presente compuesto mostrado a continuación se preparó de acuerdo con el ejemplo de preparación 1-7 con un compuesto de fórmula (1-3) en lugar de un compuesto de fórmula (1-2).

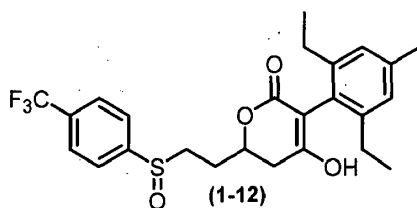
<Compuesto de fórmula 1-11>



10 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )  
 $\delta$  ppm: 8,90-8,87 (1H, m), 8,22-8,13 (2H, m), 6,99-6,96 (2H, m), 4,59-4,43 (1H, m), 3,62-3,52 (0,5H, m), 3,35-3,25 (0,5H, m), 3,10-2,24 (11H, m), 1,28-1,21 (3H, m), 1,16-1,6 (6H, m)

15 El presente compuesto se muestra a continuación se preparó según el ejemplo de preparación 1-7 con un compuesto de fórmula (1-7) en lugar de un compuesto de fórmula (1-2).

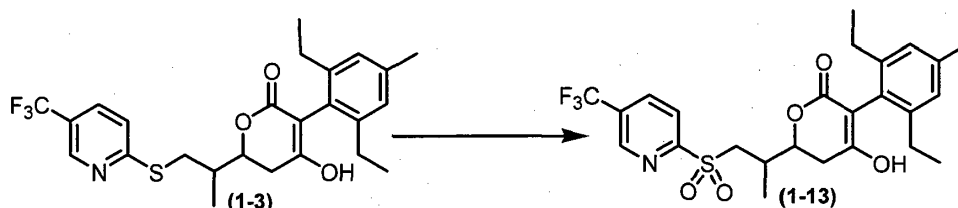
<Compuesto de fórmula 1-12>



20 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )  
 $\delta$  ppm: 7,83-7,73 (4H, m), 6,99-6,96 (2H, m), 6,33 (1H, s), 4,75-4,50 (1H, m), 3,35-1,89 (13H, m), 1,15-1,3 (6H, m)

Ejemplo de preparación 1-8: Preparación de un compuesto de fórmula (1-13)

25 <Preparación de un compuesto de fórmula 1-13>

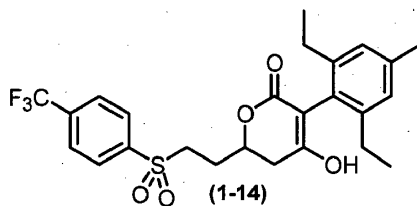


30 A RT, a 150 mg de un compuesto de fórmula (1-3) se le añadió 1 ml de cloroformo y la mezcla resultante se enfrió a 0°C con agitación, y a esto se añadió una solución de ácido meta-cloroperoxibenzoico 260 mg disuelto en 2 ml de cloroformo gota a gota y la mezcla resultante se agitó durante aproximadamente 30 minutos. Después, la solución de reacción resultante se elevó a RT y se agitó a RT durante 3 horas. La solución de reacción se diluyó con cloroformo y se lavó con una solución acuosa de sulfito de sodio al 10%. La capa de cloroformo resultante se lavó con solución salina saturada y se secó sobre  $Na_2SO_4$  *anhidro* y se filtró. El producto filtrado obtenido se concentró a presión reducida para proporcionar un aceite. El aceite obtenido se purificó por medio de cromatografía en columna ( $SiO_2$ ) eluyendo con EtOAc:hexano (1:2) para proporcionar 77,2 mg de un compuesto de fórmula (1-13).

35 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ )  
 $\delta$  ppm: 9,02 (1H, s), 8,26 (2H, s), 7,01 (1H, s), 6,98 (1H, s), 4,85-4,81 (0,5H, m), 4,50-4,44 (0,5H, m), 3,95-3,83 (1H, m), 3,53-3,40 (1H, m), 2,91-2,33 (10H, m), 1,39-1,31 (3H, m), 1,15-1,9 (6H, m)

40 El presente compuesto mostrado a continuación se preparó de acuerdo con el Ejemplo de preparación 1-8 con un compuesto de fórmula (1-7) en lugar de un compuesto de fórmula (1-3).

<Compuesto de fórmula 1-14>



RMN H<sup>1</sup> (CDCl<sub>3</sub>)

5 δ ppm: 8,09 (2H, d), 7,98 (2H, d), 7,00 (1H, s), 6,98 (1H, s), 4,73-4,66 (1H, m), 3,58-3,33 (2H, m), 2,80 -2,59 (2H, m), 2,49-2,17 (9H, m), 1,13-1,08 (6H, m)

A continuación, se muestran más abajo los ejemplos de formulación. Aquí, el presente compuesto se expresa como el número de una fórmula estructural.

10 Formulación 1

Polvo mojable

Compuesto (1-1)	50% en peso
Lignosulfonato de sodio	5% en peso
Polioxietilen alquil éter	5% en peso
Hulla blanca	5% en peso
Arcilla	35% en peso

15 Los ingredientes mostrados anteriormente se mezclan y se muelen hasta obtener un polvo mojable.

El compuesto (1-1) se reemplaza por cualquiera de los compuestos (1-2) a (1-14) para obtener las respectivas formulaciones.

20 Formulación 2

Gránulos

Compuesto (1-1)	1,5% en peso
Lignosulfonato de sodio	2% en peso
Talco	40% en peso
Bentonita	56,5% en peso

25 Los ingredientes mostrados anteriormente se mezclan, y a esto se añade agua, y la mezcla resultante se amasa completamente, y a continuación se somete a granulación y secado para obtener un gránulo.

El compuesto (1-1) se sustituye por cualquiera de los compuestos (1-2) a (1-14) para obtener las respectivas formulaciones.

30

Formulación 3

Concentrados en suspensión

Compuesto (1-1)	10% por peso
Mezcla de sal de amonio de polioxietilen alquiléter sulfato y hulla blanca (razón en peso 1: 1)	35% por peso
Agua	55% por peso

35

Los ingredientes que se muestran más arriba se mezclan, y la mezcla resultante se somete a continuación a molienda fina de acuerdo con el método de molienda en húmedo, para obtener un concentrado en suspensión.

- 5 El compuesto (1-1) se sustituye por cualquiera de los compuestos (1-2) a (1-14) para obtener las respectivas formulaciones.

A continuación, se muestran más abajo los ejemplos de ensayo.

- 10 Aquí se observó visualmente la eficacia para el control de malas hierbas del presente compuesto y se evaluó en 11 criterios de 0 a 10 (0 representa la ausencia de acción, 10 representa la muerte completa y la eficacia intermedia se evaluó en los criterios 1 a 9).

Ensayo 1-1 Ensayo de tratamiento de post-emergencia

- 15 Se introdujo tierra comercial para propagación en una maceta que medía 8 cm de diámetro y 6,5 cm de altura, y en la maceta, se sembraron semillas de *Echinochloa crus-galli*, y después se cubrieron con tierra de aproximadamente 0,5 cm de espesor y las plantas se cultivaron en un invernadero. Cuando las plantas se hicieron crecer a las etapas de 1-2 hojas, se pulverizó uniformemente una cantidad predeterminada de una solución química diluida que contenía un compuesto (1-1) sobre las plantas completas. Aquí la solución química diluida se preparó resolviendo una cantidad predeterminada del compuesto (1-1) en una solución de dimetilformamida que contenía Tween 20 al 2% (éster de ácido graso de polioxietilensorbitán) (fabricado por MP Biomedicals Inc.) y después diluyendo la solución con agua desionizada. Después de la pulverización, las plantas se cultivaron en un invernadero y después de 20 días del tratamiento, se observó la eficacia para *Echinochloa crus-galli* y se evaluó el efecto de control.

- 25 Del mismo modo, también se sometieron a ensayo los presentes compuestos (1-2) a (1-11) y (1-13).

Como resultado, los compuestos (1-1) a (1-11) y (1-13) mostraron todos una eficacia de 9 o más a una cantidad de tratamiento de productos químicos de 1.000 g/10.000 m<sup>2</sup>.

- 30 Ensayo 1-2 Ensayo de tratamiento de post-emergencia

- 35 Se introdujo tierra comercial para propagación en una maceta que medía 8 cm de diámetro y 6,5 cm de altura, y en la maceta, se sembraron semillas de *Galium aparine*, y después se cubrieron con tierra de alrededor de 0,5 cm de espesor y las plantas se cultivaron en un invernadero. Cuando las plantas se hicieron crecer a las etapas de 1-2 hojas, se pulverizó uniformemente una cantidad predeterminada de una solución química diluida que contiene un compuesto (1-1) sobre las plantas completas. Aquí la solución química diluida se preparó de manera similar al Ejemplo de ensayo 1-1. Después de la pulverización, las plantas se cultivaron en un invernadero y después de 20 días de tratamiento, se observó y se valuó la eficacia para *Galium aparine*.

- 40 Del mismo modo, también se sometieron a ensayo los presentes compuestos (1-1) y (1-10).

Como resultado, los compuestos (1-1), (1-2) y (1-10) mostraron todos una eficacia de 7 o más a una cantidad de tratamiento de productos químicos de 1.000 g/10.000 m<sup>2</sup>.

- 45 Ensayo 2-1 Ensayo de tratamiento de pre-emergencia

- 50 Se introdujo tierra de campo esterilizada con vapor de agua en una maceta que medía 8 cm de diámetro y 6,5 cm de altura, y en la maceta, se sembraron semillas de *Echinochloa crus-galli*, y después se cubrieron con tierra de espesor de aproximadamente 0,5 cm. A continuación, se pulverizó uniformemente una cantidad predeterminada de una solución química diluida que contenía un compuesto (1-1) sobre la superficie del suelo. Aquí la solución diluida química se preparó de manera similar al Ejemplo de ensayo 1-1. Después del tratamiento químico, las plantas se cultivaron en un invernadero, y después de 3 semanas de la pulverización, se observó y se evaluó la eficacia para *Echinochloa crus-galli*.

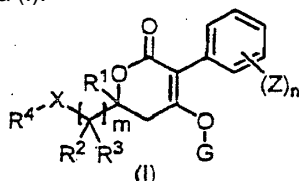
- 55 Del mismo modo, también se sometieron a ensayo los presentes compuestos (1-2) a (1-8), (1-10), (1-11) y (1-13).

Como resultado, los compuestos (1-2) a (1-8), (1-10), (1-11) y (1-13) mostraron todos una eficacia de 7 o más a una cantidad de tratamiento de productos químicos de 1.000 g/10.000 m<sup>2</sup>.

- 60

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de dihidropirona de fórmula (I):



5 [en donde

m es 1, 2 o 3;

n es un número entero de cualquiera de 1 a 5;

X representa O, S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>;

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

10 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o un grupo halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alquileo C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se combinan entre sí para representar un grupo alquilideno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> que tiene opcionalmente uno o más átomos de halógeno (con la condición de que cuando m es 2 o 3, dos o tres R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos o tres R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

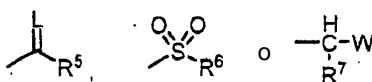
15 cuando X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> representa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido con un grupo metilo o un grupo etilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, un grupo alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo alquino C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo haloalquino C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre

20 {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxycarbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente);

35 cuando X representa O, R<sup>4</sup> representa un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros que tienen de 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre {con la condición de que el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> y el grupo heteroarilo de cinco o seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo pentafluorotio, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo hidroxycarbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, el grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, el grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más átomos de halógeno o grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, los átomos de halógeno o los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> pueden ser iguales o diferentes entre sí respectivamente);

55 G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:





{en donde

L representa un átomo de oxígeno (O) o un átomo de azufre (S);

R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquinoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, un grupo alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquenoil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)amino, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros que tiene de 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un radical arilo del grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un radical arilo del grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)amino y un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);

R<sup>5</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> pueden tener opcionalmente uno o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y cuando existen dos o más grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes entre sí);

R<sup>7</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

W representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfino o un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo (con la condición de que estos grupos pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí);

Z representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio, un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi, un grupo heteroariloxi de cinco o seis miembros, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros que tiene de 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre {con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo y el grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tio pueden tener cada uno uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, el grupo heteroarilo de cinco a seis miembros, el grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi y el grupo heteroariloxi de cinco a seis miembros pueden tener cada uno uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; y el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí; cuando n es un número entero de 2 o más, Z pueden ser iguales o diferentes entre sí}}.

2. El compuesto de dihidropirona de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

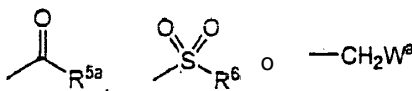
m es 1, 2 o 3;

n es un número entero de cualquiera de 1 a 3;

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> (con la condición de que cuando m es 2 o 3, dos o tres R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos o tres R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

G representa un átomo de hidrógeno o un grupo de una cualquiera de las siguientes fórmulas:



{en donde

R<sup>5a</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquenil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi, un grupo alquini(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)oxi o un grupo aril(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)oxi;

R<sup>6a</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y

W<sup>a</sup> representa un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

Z representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un grupo nitro, un grupo fenilo o un grupo heteroarilo de cinco a seis miembros (con la condición de que el grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, el grupo alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, el grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, el grupo fenilo y el grupo heteroarilo de cinco a seis miembros pueden tener opcionalmente uno o más átomos de halógeno, y cuando existen dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí).

3. El compuesto de dihidropirona acuerdo con la reivindicación 2, en donde

m es 2;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo, alternativamente R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se conectan entre sí para representar una cadena de etileno (con la condición de que dos R<sup>2</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí y dos R<sup>3</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí);

G representa un átomo de hidrógeno, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butilcarbonilo, un grupo benzoilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo aliloxycarbonilo, un grupo fenoxicarbonilo, un grupo metoximetilo o un grupo etoximetilo;

Z representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo fenilo, un grupo vinilo, un grupo ciclopropilo, un grupo nitro, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi, un grupo trifluorometilo, un grupo 5-trifluorometil-2-cloropiridiloxi o un grupo etinilo.

4. El compuesto de dihidropirona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde

X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>; y

R<sup>4</sup> representa un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido con un grupo metilo o un grupo etilo, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo haloalquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo o un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo (con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, el grupo 2-tiazolilo, el grupo 2-oxazolilo, el grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o el grupo 5-tetrazolilo puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo pentafluorotio, un grupo benzoilamino y un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí.

5. El compuesto de dihidropirona acuerdo con la reivindicación 4, en donde

X representa S, S(O) o S(O)<sub>2</sub>; y

R<sup>4</sup> representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo (con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, el grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4 tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un átomo de flúor, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo t-butilo, un grupo metoxi, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo acetilo, un grupo metoxicarbonilo, un grupo pentafluorotio, un grupo pentafluoroetilo, un grupo difluoroetilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo trifluorometiltio, un grupo benzoilamino, un grupo trifluorometoxi y un grupo trifluorometilo.

6. El compuesto de dihidropirona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde

X representa O; y

R<sup>4</sup> representa un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo (con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, el grupo 2-tiazolilo, el grupo 2-oxazolilo, el grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o el grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo hidroxilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo

pentafluorotio, un grupo benzoilamino y un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y cuando existen dos o más sustituyentes, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí.

7. El compuesto de dihidropirona acuerdo con la reivindicación 6, en donde  
5 X representa O; y  
R<sup>4</sup> representa un grupo fenilo, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 2-furilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 2-tiazolilo, un 2 grupo oxazolilo, un grupo 2-(1,3,4-tiadiazolilo) o un grupo 5-tetrazolilo {con la condición de que el grupo fenilo, el grupo 2-piridilo, grupo 3-piridilo, el grupo 4-piridilo, el grupo 2-pirimidinilo, el grupo 2-furilo, el grupo 2-tienilo, el grupo 2-tiazolilo, el grupo 2-oxazolilo, el grupo 2-  
10 (1,3,4-tiadiazolilo) o el grupo 5-tetrazolilo pueden tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un átomo de flúor, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo t-butilo, un grupo metoxi, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo acetilo, un grupo metoxicarbonilo, un grupo pentafluorotio, un grupo pentafluoroetilo, un grupo difluoroetilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo trifluorometilitio, un grupo benzoilamino, un grupo trifluorometoxi y un grupo trifluorometilo.  
15
8. El compuesto de dihidropirona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en donde G representa un átomo de hidrógeno.
- 20 9. Un herbicida que comprende un compuesto de dihidropirona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 como ingrediente activo y un portador inerte.
10. Un método para el control de las malas hierbas, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto de dihidropirona de fórmula (I) como se define en la reivindicación 1 a las malas hierbas o al suelo donde crecen las  
25 malas hierbas.
11. El uso de un compuesto de dihidropirona de fórmula (I) como se define en la reivindicación 1 para el control de las malas hierbas.