

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 645 373**

51 Int. Cl.:

**A01P 7/04** (2006.01)

**A01N 43/90** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **31.05.2006 E 09164961 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **02.08.2017 EP 2111756**

54 Título: **Agentes de control de plagas**

30 Prioridad:

**01.06.2005 JP 2005161019**

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

**05.12.2017**

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)  
Carl-Bosch-Str. 38  
67056 Ludwigshafen, DE**

72 Inventor/es:

**GOTO, KIMIHIKO;  
HORIKOSHI, RYO;  
TSUCHIDA, MARIKO;  
OYAMA, KAZUHIKO;  
OMURA, SATOSHI;  
TOMODA, HIROSHI y  
SUNAZUKA, TOSHIAKI**

74 Agente/Representante:

**ARIAS SANZ, Juan**

**Observaciones:**

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

**ES 2 645 373 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

Agentes de control de plagas

5 **Antecedentes de la invención****Campo de la invención**

10 La presente invención se refiere a una composición para su uso como agente de control de plagas que comprende un derivado de piripiropeno como ingrediente activo.

**Antecedentes de la técnica**

15 El piripiropeno A tiene actividad inhibidora contra ACAT acil-CoA: colesterol aciltransferasa) y se espera que se aplique, por ejemplo, al tratamiento de enfermedades inducidas por acumulación de colesterol, como se describe en la patente japonesa n.º 2993767 (Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 360895/1992) y Journal of Antibiotics (1993, 46(7), 1168-9).

20 Además, los análogos y derivados de piripiropeno y la actividad inhibidora de ACAT de los mismos se describen en Journal of Society of Synthetic Organic Chemistry, Japón (1998), Vol. 56, n.º 6, págs. 478-488, el documento WO 94/09417, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 184158/1994, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 239385/1996, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 259569/1996, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269062/1996, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269063/1996, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269064/1996, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269065/1996, la patente japonesa abierta al público No. 269066/1996, la Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 291164/1996, y Journal of Antibiotics (1997), 50(3), 229-36.

30 Adicionalmente, Applied and Environmental Microbiology (1995), 61(12), 4429-35 describe que el piripiropeno A tiene actividad insecticida contra larvas de *Helicoverpa zea*. Además el documento WO 2004/060065 describe que el piripiropeno A tiene actividad insecticida contra larvas de *Plutella xylostella* L y *Tenebrio molitor* L. Sin embargo en estos documentos no existe descripción específica sobre la actividad insecticida del piripiropeno A contra otras plagas.

35 Además, ninguno de los documentos anteriores describe actividad insecticida de análogos y derivados de piripiropeno.

Hasta ahora, se han expuesto muchos compuestos con actividad insecticida y se han utilizado como agentes para el control de plagas. Sin embargo, la presencia de especies de insectos, que son resistentes a o que pueden controlarse difícilmente con estos compuestos, ha planteado un problema. Por consiguiente, se ha deseado todavía el desarrollo de un nuevo agente de control de plagas con excelente actividad insecticida.

40 **Sumario de la invención**

Los presentes inventores han descubierto ahora que los nuevos derivados de piripiropeno representados por la fórmula (I) tienen actividad insecticida significativa.

45 Los presentes inventores han descubierto además que el piripiropeno A y sus derivados representados por la fórmula (Ia) tienen actividad insecticida significativa contra plagas de hemípteros.

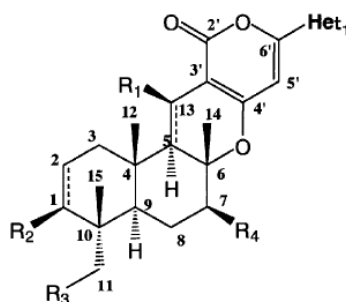
Adicionalmente, los presentes inventores han descubierto que los nuevos derivados de piripiropeno representados por la fórmula (Ib) tienen actividad insecticida significativa.

La presente invención se ha realizado en base a tales descubrimientos.

50 En consecuencia, un objeto de la presente invención es proporcionar una composición útil como un agente de control de plagas, que comprende un derivado de piripiropeno que tiene significativa actividad insecticida como ingrediente activo y puede exhibir de forma fidedigna el efecto contemplado y puede usarse con seguridad. Otro objeto de la presente invención es proporcionar un agente para el control de plagas de hemípteros que comprende piripiropeno A y sus derivados como ingrediente activo y puede exhibir de forma fidedigna el efecto contemplado y puede usarse con seguridad. Un objeto adicional de la presente invención es proporcionar un nuevo derivado de piripiropeno que tenga significativa actividad insecticida.

60 Se describe una composición para su uso como un agente de control de plagas, que comprende un compuesto representado por la fórmula (I) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como ingrediente activo y un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable:

[Fórmula química 1]



( I )

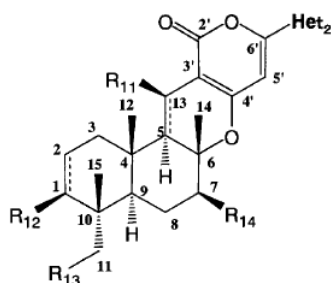
en la que

- 5 Het<sub>1</sub> representa 3-piridilo opcionalmente sustituido,  
 R<sub>1</sub> representa hidroxilo,  
 alquilcarbonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquenilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 10 alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquenilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquil C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 bencilo opcionalmente sustituido u  
 oxo en ausencia de un átomo de hidrógeno en la posición 13, o  
 15 el enlace entre la posición 5 y la posición 13 representa un doble enlace en ausencia de R<sub>1</sub> y un átomo de  
 hidrógeno en la posición 5,  
 R<sub>2</sub> representa hidroxilo,  
 alquilcarbonilo C<sub>1-18</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquenilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 20 bencilo opcionalmente sustituido o  
 alquilsulfonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 R<sub>3</sub> representa un átomo de hidrógeno,  
 hidroxilo,  
 alquilcarbonilo C<sub>1-18</sub> opcionalmente sustituido,  
 25 alquenilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 bencilo opcionalmente sustituido,  
 alquilsulfonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 bencilsulfonilo opcionalmente sustituido o  
 30 tiocarbonilo heterocíclico de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido o,  
 R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan juntos -O-CR<sub>2</sub>'R<sub>3</sub>'-O- en el que R<sub>2</sub>' y R<sub>3</sub>', que pueden ser el mismo o diferentes, representan  
 un átomo de hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub>, fenilo opcionalmente sustituido o bencilo  
 opcionalmente sustituido o R<sub>2</sub>' y R<sub>3</sub>' representan juntos oxo o alqueno C<sub>2-6</sub> y  
 35 R<sub>4</sub> representa un átomo de hidrógeno,  
 hidroxilo,  
 alquilcarbonilo C<sub>1-18</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquenilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquilcarbonilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 bencilo opcionalmente sustituido,  
 40 alquilsulfonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 bencilsulfonilo opcionalmente sustituido o  
 bencilo opcionalmente sustituido o  
 alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquenilo C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 alquil C<sub>2-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 45 alquilo C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>,  
 alquilo C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>,  
 alquilo C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>,  
 alquilo C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,  
 50 alquilaminocarbonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido,

oxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido,  
 carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido,  
 tieno[3,2-b]piridilcarboniloxi opcionalmente sustituido,  
 1H-indolcarboniloxi opcionalmente sustituido,  
 5 tiocarboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido u  
 oxo en ausencia de un átomo de hidrógeno en la posición 7, con la condición de que  
 se excluya  
 un compuesto en el que  
 Het<sub>1</sub> represente 3-piridilo,  
 10 R<sub>1</sub> represente hidroxilo y  
 todos de R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> representen acetiloxi.

De acuerdo con un aspecto de la presente invención, se proporciona un uso no terapéutico de un compuesto  
 15 representado por la fórmula (Ia) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como agente de control de  
 plagas de hemípteros y un método para controlar una plaga de hemípteros, que comprende aplicar una cantidad  
 eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ia) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo a  
 una planta o al terreno:

[Fórmula química 2]

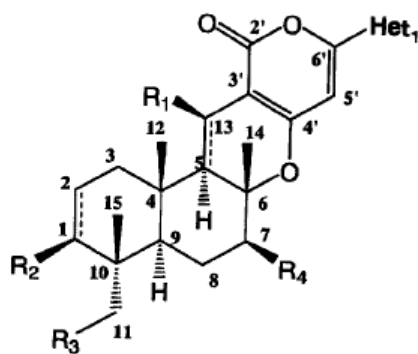


(I a)

20 en la que  
 Het<sub>2</sub> representa 3-piridilo,  
 R<sub>11</sub> representa hidroxilo,  
 R<sub>12</sub> representa acetoxi,  
 25 R<sub>13</sub> representa acetoxi y  
 R<sub>14</sub> representa acetoxi.

Además, el derivado de piriropeno de acuerdo con la presente invención comprende un compuesto representado  
 30 por la fórmula (Ib) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo:

[Fórmula química 3]



(I b)

en la que  
 35 Het<sub>1</sub> representa 3-piridilo,  
 R<sub>1</sub> representa hidroxilo,

R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan propioniloxi o alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido y  
R<sub>4</sub> representa hidroxilo,

alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido,  
benzoiloxi opcionalmente sustituido o

5 carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido.

Los derivados de piriropeno representados por la fórmula (Ia) o la fórmula (Ib) de acuerdo con la presente invención tienen excelente efecto de control contra plagas agrícolas y hortícolas, plagas sanitarias, parásitos de animales, plagas de grano almacenado, plagas de prendas de vestir y plagas de casas y una composición que  
10 comprenda los derivados de piriropeno como ingrediente activo puede utilizarse ventajosamente como un nuevo agente para el control de plagas.

Por lo tanto, en otro aspecto, la presente invención se refiere a una composición para su uso como un agente de control de plagas que comprende el compuesto de fórmula (Ib), o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo, como ingrediente activo y un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable. En otro aspecto, la presente invención se refiere a un uso no terapéutico de un compuesto representado por la fórmula (Ib), o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo, como un agente de control de plagas. De acuerdo con otro aspecto, la presente invención se refiere a un método para controlar una plaga, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ib) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo a una planta o al terreno.

Además, es sorprendente que, entre los compuestos representados por la fórmula (Ia), el piriropeno A tiene excelente efecto de control contra plagas de hemipteros. En consecuencia, una composición de acuerdo con la presente invención que comprende los compuestos representados por la fórmula (Ia) incluyendo piriropeno A, puede utilizarse ventajosamente en particular como agente de control de plagas de hemipteros.

## 25 Descripción detallada de la invención

El término "halógeno" como se usa en el presente documento significa flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente flúor, cloro o bromo.

Los términos "alquilo", "alqueno" y "alquino" como se usan en el presente documento como un grupo o una parte de un grupo respectivamente significan alquilo, alqueno y alquino que el grupo es de cadena recta, de cadena ramificada o tipo cíclica o un tipo de una combinación de los mismos salvo que se especifique de otra manera. Además, por ejemplo, "C<sub>1-6</sub>" en "alquilo C<sub>1-6</sub>" como se usa en el presente documento como un grupo o una parte de un grupo significa que el número de átomos de carbono en el grupo alquilo es 1 a 6. Además, en el caso de alquilo cíclico, el número de átomos de carbono es al menos tres.

La frase "anillo heterocíclico" como se usa en el presente documento significa un anillo heterocíclico que contiene uno o más, preferentemente uno a cuatro, heteroátomos, que pueden ser el mismo o diferentes, seleccionados del grupo que consiste en átomos de nitrógeno, oxígeno y azufre. Además, la expresión alquilo "opcionalmente sustituido" como se usa en el presente documento significa que uno o más átomos de hidrógeno en el grupo alquilo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes que pueden ser el mismo o diferente. Será evidente para un experto con habilidad ordinaria en la materia que el número máximo de sustituyentes puede determinarse dependiendo del número máximo de átomos de hidrógeno sustituibles en el grupo alquilo. Esto es cierto para grupos funcionales distintos del grupo alquilo.

El 3-piridilo representado por Het<sub>1</sub> y Het<sub>2</sub> está opcionalmente sustituido y los sustituyentes incluyen átomos halógenos, alquilo C<sub>1-4</sub>, alquiloxi C<sub>1-4</sub>, nitro, ciano, formilo, trifluorometilo, trifluorometoxi, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, acetilo y acetoxi. Se prefieren los átomos halógenos y trifluorometilo. Son más preferidos un átomo de cloro y trifluorometilo.

"Alquilcarboniloxi C<sub>1-18</sub>" representado por R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> y R<sub>12</sub>, R<sub>13</sub> y R<sub>14</sub> es preferentemente alquilcarboniloxi C<sub>1-6</sub>, más preferentemente propioniloxi o alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico. El grupo alquilcarboniloxi C<sub>1-18</sub> está opcionalmente sustituido y los sustituyentes incluyen átomos halógenos, ciano, alquilo C<sub>3-6</sub> cíclico, fenilo, trifluorometoxi, trifluorometiltio, piridilo y piridiltio. Los más preferidos son átomos halógenos, alquilo C<sub>3-6</sub> cíclico y piridilo.

"Alquiloxi C<sub>1-6</sub>" representado por R<sub>1</sub> y R<sub>4</sub> y R<sub>11</sub> y R<sub>14</sub> está opcionalmente sustituido y los sustituyentes incluyen átomos halógenos; ciano; fenilo; trifluorometoxi; trifluorometiltio; alquilcarbonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; y alquilcarboniloxi C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno.

Fenilo en "benciloxi" representado por R<sub>4</sub> y R<sub>14</sub> está opcionalmente sustituido y los sustituyentes incluyen átomos halógenos; alquiloxi C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno.

Fenilo en "benciloxi" representado por R<sub>4</sub> está opcionalmente sustituido y los sustituyentes incluyen átomos halógenos; alquiloxi C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilcarbonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilcarboniloxi C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilaminocarboniloxi C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilaminocarbonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilsulfoniloxi C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo

halógeno; alquiltio C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilsulfino C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; alquilsulfonilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con un átomo halógeno; ciano; nitro; formilo; azida; guanidilo; grupo -C(=N)-NH<sub>2</sub>; y grupo -CH=N-O-CH<sub>3</sub>. Los preferidos son átomos halógenos, alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido con un átomo halógeno, ciano y nitro.

5 “Anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado” en “oxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado”, “carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado” y “tiocarboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado” representados por R<sub>4</sub> es un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene uno a tres heteroátomos seleccionados del grupo que  
10 consiste en átomos de nitrógeno, oxígeno y azufre, más preferentemente, un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en átomos de nitrógeno, oxígeno y azufre, más preferentemente, un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene uno o dos átomos de nitrógeno, un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene uno o dos átomos de oxígeno, un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene uno o dos átomos de azufre, un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno o un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre.

En la presente invención, los “anillos heterocíclicos de cinco o seis miembros saturados o insaturados” son tienilo, furilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, oxazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, tetrahidropiranilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo y manosilo. Se prefieren piridilo, furanilo, tiazolilo, imidazolilo, tetrahidropiranilo y manosilo. Los ejemplos más específicos de los mismos incluyen (2- o 3-)tienilo, (2- o 3-)furilo, (1-, 2- o 3-)pirrolilo, (1-, 2-, 4- o 5-)imidazolilo, (1-, 3-, 4- o 5-)pirazolilo, (3-, 4- o 5-)isotiazolilo, (3-, 4- o 5-)isoxazolilo, (2-, 4- o 5-)tiazolilo, (2-, 4- o 5-)oxazolilo, (2-, 3- o 4-)piridilo o (2-, 4-, 5- o 6-)pirimidinilo, (2- o 3-)pirazinilo, (3- o 4-)piridazinilo, (2-, 3- o 4-)tetrahidropiranilo, (1-, 2-, 3- o 4-)piperidinilo, (1-, 2- o 3-)piperazinilo y (2-, 3- o 4-)morfolinilo, preferentemente 3-piridilo, 2-franilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 5-imidazolilo y 2-tetrahidropiranilo, más preferentemente 2-tetrahidropiranilo, 2-pirazinilo y 3-piridilo, en particular preferentemente 3-piridilo.

El anillo heterocíclico en el “carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado” y “tiocarboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado” y “tieno[3,2-b]piridilcarboniloxi” y “1H-indolilcarboniloxi” representados por R<sub>4</sub> están opcionalmente sustituidos y los sustituyentes incluyen átomos halógenos, alquilo C<sub>1-4</sub>, alquiloxi C<sub>1-4</sub>, alquiltio C<sub>1-4</sub>, nitro, ciano, formilo, trifluorometoxi, trifluorometilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfino, trifluorometilsulfonilo, acetilo, acetiloxi, benzoilo y alquilocarbonilo C<sub>1-4</sub>. Se prefieren átomos halógenos, alquilo C<sub>1-4</sub>, alquiloxi C<sub>1-4</sub> y trifluorometilo.

35 Una composición para su uso como un agente de control de plagas de hemípteros, que comprende un compuesto representado por la fórmula (Ia)

De acuerdo con la presente invención, en el compuesto representado por la fórmula (Ia), Het<sub>2</sub> representa 3-piridilo. Además, de acuerdo con la presente invención, en el compuesto representado por la fórmula (Ia), R<sub>11</sub> representa hidroxilo.

De acuerdo con la presente invención, en el compuesto representado por la fórmula (Ia), R<sub>12</sub> representa acetiloxi.

En la presente invención, en el compuesto representado por la fórmula (Ia), R<sub>13</sub> representa acetiloxi.

De acuerdo con la presente invención, en el compuesto representado por la fórmula (Ia), R<sub>14</sub> representa acetiloxi.

Además, una sal agrícola y hortícolamente aceptable del compuesto representado por la fórmula (Ia) incluye lo mismo que el compuesto representado por la fórmula (Ib) descrita a continuación.

50 Compuestos de fórmula (Ib) o sus sales agrícola y hortícolamente aceptables.

Los compuestos de fórmula (Ib) son nuevos derivados de piriropeno que están comprendidos como una parte en el compuesto representado por la fórmula (I). En particular, tienen significativa actividad insecticida.

De acuerdo con una realización de la presente invención, se proporcionan los compuestos de fórmula (Ib), excluyendo un compuesto en el que Het<sub>1</sub> represente 3-piridilo, R<sub>1</sub> represente hidroxilo y R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representen propioniloxi y R<sub>4</sub> represente hidroxilo.

De acuerdo con otra realización preferida de la presente invención, en el compuesto representado por la fórmula (Ib), R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido, R<sub>4</sub> representa hidroxilo, alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido o benzoiloxi opcionalmente sustituido. Alternativamente, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan propioniloxi, R<sub>4</sub> representa alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido o carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido.

De acuerdo con otra realización preferida de la presente invención, en los compuestos representados por la fórmula

(Ib), R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido, R<sub>4</sub> representa hidroxilo, alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido o benzoiloxi opcionalmente sustituido.

De acuerdo con otra realización preferida de la presente invención, en los compuestos representados por la fórmula (Ib), R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan propioniloxi, R<sub>4</sub> representa alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido o carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido.

De acuerdo con aún una realización preferida de la presente invención, se proporciona una composición para su uso como un agente de control de plagas que comprende un compuesto representado por la fórmula (Ib) o un sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como un ingrediente activo y un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable.

Las sales agrícola y hortícolamente aceptables en los compuestos de fórmula (Ib) incluyen, por ejemplo, sales de adición de ácido, tales como clorhidratos, nitratos, sulfatos, fosfatos o acetatos.

Los ejemplos específicos de los compuestos representados por la fórmula (Ia) o (Ib) incluyen ciertos compuestos mostrados en las Tabla 1 a 14 a continuación. En las siguientes tablas, H (=) significa que el enlace entre la posición 5 y la posición 13 representa un doble enlace en ausencia de R<sub>1</sub> y un átomo de hidrógeno en la posición 5.

[Tabla 1]

Tabla 1

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
1	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
2	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-piridilo
3	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-piridilo
4	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
5	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	3-piridilo
6	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
7	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
8	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
9	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
10	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
11	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>16</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
12	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-piridilo
13	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-piridilo
14	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-piridilo
15	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-piridilo
16	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-trans-CH=CHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
17	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CECCH <sub>3</sub>	3-piridilo
18	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCECCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
19	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CeCH	3-piridilo
20	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH = CH <sub>2</sub>	3-piridilo

[Tabla 2]

Tabla 2

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
21	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
22	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
23	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
24	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
25	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(4-N <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
26	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
27	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
28	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(3-piridilo)	3-piridilo
29	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(2-Cl-3-piridilo)	3-piridilo
30	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(2-franilo)	3-piridilo
31	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(2-tiazolilo)	3-piridilo
32	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(2-Cl-5-tiazolilo)	3-piridilo
33	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-(5-imidazolilol)	3-piridilo

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
34	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCS-(1-imidazolilo)	3-piridilo
35	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
36	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
37	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
38	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCONHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
39	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
40	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo

[Tabla 3]

Tabla 3

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
41	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
42	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-piridilo
43	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-piridilo
44	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-piridilo
45	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	O-(2-tetrahydropyranilo)	3-piridilo
46	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	O-(tetra-O-bencil.manosilo)	3-piridilo
47	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	H	3-piridilo
48	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
49	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
50	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	=O	3-piridilo
51	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
52	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
53	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	3-piridilo
54	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
55	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
56	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
57	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
58	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
59	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OH	3-piridilo
60	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OCS-(1-imidazolilo)	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo

5

[Tabla 4]

Tabla 4

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
Compuesto de referencia 61	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 62	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 63	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 64	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 65	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 66	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
Compuesto de referencia 67	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
Compuesto de referencia 68	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OH	OH	3-piridilo
Compuesto de referencia 69	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OH	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 70	OH	OCOCH <sub>3</sub>	H	H	3-piridilo
Compuesto de referencia 71	OH	OCOCH <sub>3</sub>	H	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 72	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
73	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
74	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 75	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 76	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 77	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 78	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	3-piridilo
Compuesto de referencia 79	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3-piridilo
Compuesto de referencia 80	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo



[Tabla 5]

Tabla 5

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
81	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
82	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
83	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
84	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
85	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
86	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
87	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
88	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
89	OH	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
90	OH	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-piridilo
91	OH	OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-piridilo
92	OH	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
93	OH	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
94	OH	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
95	OH	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
96	OH	OCO-(4-BR-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	OCO-(4-BR-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	OCO-(4-BR-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
97	OH	OCO-(4-N <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
98	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
99	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
100	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo

5 [Tabla 6]

Tabla 6

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
101	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	OH	3-piridilo
102	OH	OH	OH	OH	3-piridilo
103	OH	OH	OH	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
104	OH	OH	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
105	OH	OH	OH	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-piridilo
106	OH	OH	OCOCH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
107	OH	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
108	OH	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
109	OH	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
110	OH	OH	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH	3-piridilo
111	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
112	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
113	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
114	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH	3-piridilo
115	OH	OH	OSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OH	3-piridilo
116	OH	OH	OSO <sub>2</sub> -(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	OH	3-piridilo
117	OH	OH	OCO-(4-BR-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	OH	3-piridilo
118	OH	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
119	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
120	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo

[Tabla 7]

10

Tabla 7

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
121	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
122	OH	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
123	OH	OH	OSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
124	OH	OH	OSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
125	OH	-O-CH(CH <sub>3</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
126	OH	-O-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo
127	OH	-O-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
128	OH	-O-CH(CH = CH <sub>2</sub> )-O-		OH	3-piridilo
129	OH	-O-CH(CH = CH <sub>2</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
130	OH	-O-CH(CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-O-		OH	3-piridilo
131	OH	-O-CH(CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
132	OH	-O-CH(OCH <sub>3</sub> )-O-		OH	3-piridilo
133	OH	-O-CH(C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
134	OH	-O-CH(CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo
135	OH	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O-		OH	3-piridilo
136	OH	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O-		OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
137	OH	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
138	OH	-O-C(CH <sub>3</sub> )(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo
139	OH	-O-C(CH <sub>3</sub> )(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
140	OH	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo

[Tabla 8]

Tabla 8

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
141	OH	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
142	OH	-O-CH(OCH <sub>3</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
143	OH	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
144	OH	-O-CH(3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
145	OH	-O-CH(3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
146	OH	-O-CH(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
147	OH	-O-CH(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
148	OH	-O-CH(3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
149	OH	-O-CH(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
150	OH	-O-CH(4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
151	OH	-O-CH(4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
152	OH	-O-CH(4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
153	OH	-O-CH(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
154	OH	-O-CH(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
155	OH	-O-C(espiro-c-C <sub>5</sub> H <sub>8</sub> )-O-		OH	3-piridilo
156	OH	-O-C(espiro-c-C <sub>5</sub> H <sub>8</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
157	OH	-O-C(espiro-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub> )-O-		OH	3-piridilo
158	OH	-O-C(espiro-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
159	OH	-O-CO-O-		OH	3-piridilo
160	OH	-O-CO-O-		OCO-1-imidazolilo	3-piridilo

5

[Tabla 9]

Tabla 9

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
161	OH		-O-CO-O-	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
162	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
163	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
164	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
165	OCOCH <sub>3</sub>	OH	OH	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
166	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
167	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
168	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
169	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
170	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
171	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
172	OCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
173	H(=)	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
174	H(=)	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
175	H(=)	OH	OH	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
176	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	=O	3-piridilo
177	H(=)	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
178	H(=)	-O-CH(CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-O-		OH	3-piridilo
179	H(=)	-O-CH(4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
180	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo

[Tabla 10]

Tabla 10

N.º de Compuesto de referencia	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
181	H(=)	OH	OH	OH	3-piridilo
182	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
183	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-piridilo
184	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-piridilo
185	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
186	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Ph	3-piridilo
187	H(=)	OCOCH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
188	H(=)	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
189	H(=)	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
190	H(=)	OH	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
191	H(=)	OH	OH	OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
192	H(=)	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O-		OH	3-piridilo
193	H(=)	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
194	H(=)	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo
195	H(=)	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
196	H(=)	-O-CH(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo
197	H(=)	-O-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo
198	H(=)	-O-CH(C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-O-		OH	3-piridilo
199	H(=)	-O-CH(CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OH	3-piridilo
200	=O	OH	OH	OH	3-piridilo

5

[Tabla 11]

Tabla 11

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
Compuesto de referencia 201	=O	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	=O	3-piridilo
Compuesto de referencia 202	=O	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OH	3-piridilo
Compuesto de referencia 203	=O	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 204	=O	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
205	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 206	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 207	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-piridilo
208	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
209	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(1-imidazolilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 210	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
211	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O-(2-tetrahidropiranilo)	3-piridilo
212	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(6-Cl-3-piridilo)	3-piridilo
213	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
214	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-C-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 215	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH=CH	3-piridilo
216	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-piridilo)	3-piridilo
217	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-piridilo)	3-piridilo

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
218	OH	OCO-C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
219	OH	OCO-C-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	OCO-C-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	OCO-C-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 220	OH	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo

[Tabla 12]

Tabla 12

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
221	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(6-CF <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
222	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-CF <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 223	OH	OCOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 224	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 225	= O	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Cl-3-piridilo
226	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Cl-3-piridilo
227	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-F-4-piridilo)	3-piridilo
228	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-Cl-4-piridilo)	3-piridilo
229	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-CH <sub>3</sub> -2-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 230	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -2-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 231	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -2-piridilo)	3-piridilo
232	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(6-F-3-piridilo)	3-piridilo
233	OH	OCO-c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	OCO-C-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	OCO-C-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	3-piridilo
234	OH	OCO-c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	OCO-c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	OCO-c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 235	OH	OCOCH <sub>2</sub> CN	OCOCH <sub>2</sub> CN	OCOCH <sub>2</sub> CN	3-piridilo
Compuesto de referencia 236	OCOCH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
237	OH	OCOCH <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCOCH <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 238	OH	OCO-(1-CH <sub>3</sub> -2,2-diF-c-C <sub>3</sub> H <sub>2</sub> )	OCO-(1-CH <sub>3</sub> -2,2-diF-c-C <sub>3</sub> H <sub>2</sub> )	OCO-(1-CH <sub>3</sub> -2,2-diF-c-C <sub>3</sub> H <sub>2</sub> )	3-piridilo
239	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-CH <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
240	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-Cl-3-piridilo)	3-piridilo

5

[Tabla 13]

Tabla 13

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
Compuesto de referencia 241	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-COOCH <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 242	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-[5-(CF <sub>3</sub> )-tieno[3,2-b]piridin-6-ilo]	3-piridilo
243	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
Compuesto de referencia 244	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
245	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
246	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
247	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-Cl-3-piridilo)	3-piridilo
248	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(2-Cl-6-CH <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 249	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-piridilo
250	OH	OCO-(2,2-diF-c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub> )	OCO-(2,2-diF-c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub> )	OCO-(2,2-diF-c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub> )	3-piridilo
Compuesto de referencia 251	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-SC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -2-piridilo)	3-piridilo
252	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3,5-diF-2-piridilo)	3-piridilo
253	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-2-pirazinilo	3-piridilo
254	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-4-tiazolilo	3-piridilo

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
255	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-Cl-2-tienilo)	3-piridilo
256	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(6-CH <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
257	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(6-Cl-2-piridilo)	3-piridilo
258	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(6-F-2-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 259	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(1-CH <sub>3</sub> -1H-indolilo)	3-piridilo
260	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-Cl-2-piridilo)	3-piridilo

[Tabla 14]

Tabla 14

N.º de Compuesto	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Het <sub>1</sub>
261	OH	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OH	3-piridilo
262	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(2-F-3-piridilo)	3-piridilo
263	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
264	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
265	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO-(3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
Compuesto de referencia 266	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> (2-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 267	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> (3-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 268	OH	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>2</sub> S(4-piridilo)	3-piridilo
269	OH	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-(2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	3-piridilo
270	OH	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO(4-CF <sub>3</sub> -3-piridilo)	3-piridilo
271	OH	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	OCO(3-Cl-2-piridilo)	3-piridilo
Compuesto de referencia 272	OH	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		=O	3-piridilo
Compuesto de referencia 273	OH	-O-CH(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		=O	3-piridilo
Compuesto de referencia 274	OCO(C H <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C h <sub>3</sub>	-O-CO-O-		OCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 275	ococh <sub>3</sub>	-O-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-O-		OCOCH <sub>3</sub>	3-piridilo
Compuesto de referencia 276	= 0	-O-CH(4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-O-		OH	3-piridilo

5

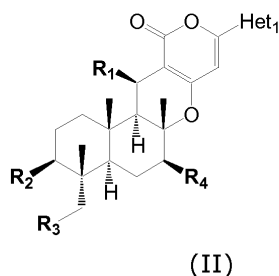
Proceso de producción

La composición de acuerdo con la presente invención puede prepararse mezclando el compuesto representado por la fórmula (Ia) o (Ib) como ingrediente activo con un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable. El compuesto representado por la fórmula (Ia) o (Ib) de acuerdo con la presente invención puede producirse de acuerdo con el siguiente procedimiento.

Entre los compuestos de acuerdo con la presente invención, los compuestos representados por la fórmula (II) pueden sintetizarse con el método descrito en Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 259569/1996, Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269062/1996, Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269065/1996, o *Journal of Antibiotics* (1997), 50(3), págs. 229-36. Cuando se utiliza piripiropeno A como el material de partida, puede utilizarse como dicho material de partida piripiropeno A, producido con el método descrito en *Journal of Society of Synthetic Organic Chemistry*, Japón (1998), Vol. 56, No. 6, págs. 478-488 o el documento WO 94/09417.

20

[Formula Química 4]



en la que

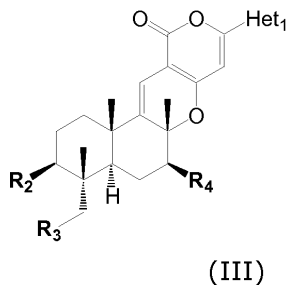
R<sub>1</sub> representa hidroxilo, y

5 R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son como se ha definido en la fórmula (Ia) o (Ib).

Además, entre los compuestos de acuerdo con la presente invención, los compuestos representados por la fórmula (III) pueden sintetizarse con el método descrito en Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269063/1996 o Publicación de patente japonesa abierta al público n.º 269066/1996.

10

[Fórmula Química 5]



15 en la que R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son como se ha definido en la fórmula (Ia) o (Ib).

#### Uso

Las especies de insectos contra los que los derivados de piripiropeno de fórmula (I) o (Ib) de acuerdo con la presente invención tienen efecto de control incluyen plagas de lepidópteros, por ejemplo, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Pseudaletia separata*, oruga verde, *Plutella xylostella*, *Spodoptera exigua*, *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Tortricidae*, *Carposinidae*, *Lyonetiidae*, *Lymantriidae*, plagas pertenecientes al género *Agrotis* spp., plagas pertenecientes al género *Helicoverpa* spp. y plagas pertenecientes al género *Heilothis* spp.; plagas de hemípteros, por ejemplo, *Aphidoidea* incluyendo *Aphididae*, *Adelgidae* y *Phylloxeridae* tales como *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Aphis fabae*, *Aphis maidis* (áfidos de la hoja de maíz), *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Aphis craccivora*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum avenae*, *Metopolophium dirhodum*, *Rhopalosiphum padi*, *Schizaphis graminum*, *Brevicoryne brassicae*, *Lipaphis erysimi*, *Aphis citricola*, áfido rosa de la manzana, *Eriosoma lanigerum*, *Toxoptera aurantii* y *Toxoptera citricidus*; *Deltocephalidae* tales como *Nephotettix cincticeps*, *Delphacidae* tales como *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens* y *Sogatella furcifera*; *Pentatomidae* tales como *Eysarcoris ventralis*, *Nezara viridula* y *Trigonotylus coelestialium*; *Aleyrodidae* tales como *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci* y *Trialeurodes vaporariorum*; *Diaspididae*, *Margarodidae*, *Ortheziidae*, *Aclerdiidae*, *Dactylopiidae*, *Kerridae*, *Pseudococcidae*, *Coccidae*, *Eriococcidae*, *Asterolecaniidae*, *Beesonidae*, *Lecanodiaspididae*, o *Cerococcidae*, tales como *Pseudococcus comstocki* y *Planococcus citri* Risso; plagas de coleópteros, por ejemplo, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Callosobruchus chienensis*, *Tenebrio molitor*, *Diabrotica virgifera*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Anomala cuprea*, *Anomala rufocuprea*, *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Oulema oryzae*, *Carposinidae* y *Cerambycidae*; Ácaros, por ejemplo, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai* y *Panonychus citri*; plagas de himenópteros, por ejemplo, *Tenthredinidae*; plagas de ortópteros, por ejemplo, *Acrididae*; plagas de dípteros, por ejemplo, *Muscidae* y *Agromyzidae*; plagas de tisanópteros, por ejemplo, *Thrips palmi* y *Frankliniella occidentalis*; Nematodos parasíticos de plantas, por ejemplo, *Meloidogyne hapla*, *Pratylenchus* spp., *Aphelenchoides besseyi* y *Bursaphelenchus xylophilus*; y parásitos de animales, por ejemplo, *Siphonaptera*, Anoplura, ácaros tales como *Boophilus microplus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Rhipicephalus sanguineus* y *Scarcoptes scabiei*. Se prefieren plagas de hemípteros.

El compuesto representado por la fórmula (Ia) de acuerdo con la presente invención tiene un control significativo contra plagas de hemípteros. Las plagas de hemípteros preferidas se seleccionan de *Aphidoidea* tales como *Aphididae*, *Adelgidae* y *Phylloxeridae*, en particular preferentemente *Aphididae*; *Coccoidea* tales como *Diaspididae*,

45

*Margarodidae, Ortheziidae, Aclerdiidae, Dactylopiidae, Kerridae, Pseudococcidae, Coccidae, Eriococcidae, Asterolecaniidae, Beesonidae, Lecanodiaspididae y Cerococcidae; y Aleyrodidae. Los más preferidos son Myzus persicae, Aphis gossypii, Aphis fabae, Aphis maidis (áfido de las hojas del maíz), Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Aphis craccivora, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum avenae, Metopolophium dirhodum, Rhopalosiphum padi, Schizaphis graminum, Brevicoryne brassicae, Lipaphis erysimi, Aphis citricola, áfido rosado de la manzana, Eriosoma lanigerum, Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus y Pseudococcus comstocki.*

La composición de acuerdo con la presente invención puede prescribirse en cualquier formulación adecuada, tales como concentrados emulsionables, formulaciones líquidas, suspensión, polvo humectable, fluidos, polvo, gránulos, tabletas, soluciones oleaginosas, aerosoles o agentes formadores de humo utilizando vehículos apropiados agrícola y hortícolamente aceptables. En consecuencia, el vehículo incluye vehículos sólidos, vehículos líquidos, vehículos gaseoso, tensioactivos, dispersantes y/u otros adyuvantes para formulaciones y similares.

Los vehículos sólidos utilizables en el presente documento incluyen, por ejemplo, talco, bentonita, arcilla, caolín, tierra de diatomeas, vermiculita, carbón blanco y carbonato cálcico.

Los ejemplos de vehículos líquidos incluyen: alcoholes, tal como metanol, n-hexanol y etilenglicol; cetonas, tal como acetona, metil etil cetona, y ciclohexanona; hidrocarburos alifáticos tal como n-hexano, querosina y queroseno; hidrocarburos aromáticos, tal como tolueno, xileno, y metilnaftaleno; éteres, tal como éter dietílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tal como acetato de etilo; nitrilos, tal como acetonitrilo e isobutironitrilo; amidas de ácido, tal como dimetilformamida y dimetilacetamida; aceites vegetales, tales como aceite de soja y aceite de semilla de algodón; sulfóxido de dimetilo; y agua.

Los vehículos gaseosos incluyen, por ejemplo, LPG, aire, nitrógeno, dióxido de carbono y dimetil éter.

Los tensioactivos o dispersantes utilizables, por ejemplo, para emulsionar, dispersar o esparcir incluyen, por ejemplo, ésteres alquilsulfónicos, sales de ácido alquil(aril)sulfónico, alquil(aril) éteres de polioxialquileno, ésteres de alcohol polihídrico, y sales de ácido lignin sulfónico.

Los adyuvantes utilizables para mejorar las propiedades de las formulaciones incluyen, por ejemplo, carboximetilcelulosa, goma arábiga, polietilenglicol y estearato de calcio.

Los vehículos, tensioactivos, dispersantes y adyuvantes anteriores pueden utilizarse solos o en combinación según las necesidades.

El contenido del ingrediente activo en la formulación no está particularmente limitado. Sin embargo, en general, el contenido del ingrediente activo es del 1 al 75 % en peso para concentrados emulsionables, del 0,3 al 25 % en peso para polvo, del 1 al 90 % en peso para polvo humectable y del 0,5 al 10 % en peso para gránulos.

El compuesto representado por la fórmula (Ia), (Ib), o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo y las formulaciones anteriores que comprenden las mismas pueden aplicarse tal cual, o después de dilución, a las plantas o al terreno. Por lo tanto, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención, se proporciona un método para controlar una plaga, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ia) o (Ib) o una sal respectiva agrícola y hortícolamente aceptable a una planta o terreno. De acuerdo con todavía otro aspecto de la presente invención, se proporciona un método para controlar una plaga de hemípteros, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ia) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo a una planta o al terreno. De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un método para controlar una plaga, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ib) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo a una planta o al terreno. Los métodos preferidos utilizables para aplicar el compuesto o formulación a plantas o terreno incluyen tratamiento de esparcimiento, tratamiento del terreno, tratamiento de la superficie y tratamiento de fumigación.

Los tratamientos de esparcimiento incluyen, por ejemplo, aplicación de esparcimiento, pulverizado, nebulizado, atomizado, granular, y aplicación de anegado. Los tratamientos del terreno incluyen, por ejemplo, ducha de afusión y mezcla del terreno. Los ejemplos de tratamientos superficiales incluyen, por ejemplo, recubrimiento, recubrimiento de polvo y cubrición. Los tratamientos de fumigación incluyen, por ejemplo, cubrición del terreno con una película de polietileno después de inyección del terreno. En consecuencia, el método de control de acuerdo con la presente invención comprende un método en el que el compuesto representado por la fórmula (Ia) o (Ib) o una formulación que comprende el mismo se aplica mediante fumigación en un espacio sellado.

La composición de acuerdo con la presente invención puede utilizarse como una mezcla o en una combinación con, por ejemplo, otros insecticidas, fungicidas, mitocidas, herbicidas, agentes reguladores del crecimiento de plantas o fertilizantes. Los agentes que pueden mezclarse o utilizarse en combinación incluyen los descritos, por ejemplo en The Pesticide Manual, 13ª edición, publicado por The British Crop Protection Council; y SHIBUYA INDEX, la 10ª edición, 2005, publicado por SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP. Más concretamente los insecticidas aquí utilizables incluyen, por ejemplo compuestos de éster de organofosfato tales como acefato, diclorvos, EPN, fenitrothion, fenamifos, protiofos, profenofos, piraclifos, clorpirifosmetil, y diazinon; compuestos de carbamato tales

como metomil, tiodicarb, aldicarb, oxamil, propoxur, carbaril, fenobucarb, etiofencarb, fenotiocarb, pirimicarb, carbofuran, y benfuracarb; derivados de nereistoxin tal como cartap y thiociclam; compuestos de organocloro tales como dicofol y tetradifon; compuestos piretroides tales como permetrina, teflutrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, fenvalerato, fluvalinato, etofenprox, y silafluofen; compuestos de benzourea tales como diflubenzurona, teflubenzurona, flufenoxurona, y clorfluazurona; compuestos hormonales juveniles tales como metopreno; y compuestos hormonales de muda de plumas tal como cromafenozida. Otros compuestos aquí utilizables incluyen buprofezin, hexitiazox, amitraz, clordimeform, piridaben, fenpiroximato, pirimidifen, tebufenpirad, fluacirpirim, acequinocil, ciflumetofen, flubendiamida, etiprole, fipronil, etoxazol, imidacloprid, clotianidin, pimetrozina, bifenazato, espiroclufen, espiromesifen, flonicamid, clorfenapir, piriproxifeno, indoxacarb, piridalil, o espinosad, avermectin, milbemycin, compuestos organometálicos, compuestos dinitro, compuestos organosulfurados, compuestos de urea, compuestos de triacina, compuestos de hidracina.

La composición de acuerdo con la presente invención puede utilizarse también como una mezcla o en una combinación con plaguicidas microbianos tales como formulaciones de BT y agentes virales entomopatogénicos.

Los fungicidas utilizables en el presente documento incluyen, por ejemplo, compuestos de estrobilurinas tales como azoxistrobin, kresoxim-metil, y trifloxistrobin; compuestos de anilinoimidazolidinona tal como mepanipirim, pirimetanil, y ciprodinil; compuestos de azol tal como triadimefon, bitertanol; triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, miclobutanil, ciproconazol, tebuconazol, hexaconazol, procloraz, y simeconazol; compuestos de quinoxalina tal como quinometionato; ditiocarbamato compuestos tales como maneb, zineb, mancozeb, policarbamato, y propineb; compuestos de fenilcarbamato tales como dietofencarb; compuestos de organocloro tales como clorotalonil y quintozeno; compuestos de benzimidazol tales como benomil, thiofanato-metil, y carbendazol; compuestos de fenilamida tales como metalaxil, oxadixil, ofurace, benalaxil, furalaxil, y ciprofuram; compuestos de ácido sulfénico tales como diclofluanid; compuestos de cobre tales como hidróxido de cobre y oxina-cobre; compuestos de isoxazol tales como hidroxisoxazol; compuestos de organofósforo tales como fosetil-aluminio y tolclofos-metil; compuestos de N-halogenotioalquilo tales como captan, captafol, y folpet; compuestos de dicarboxiimida tales como procimidona, iprodiona, y vinclozolin; compuestos de benzanilida tales como flutolanil y mepronil; compuestos de morfolina tales como fenpropimorf y dimetomorf; compuestos de organoestaño tales como hidróxido de trifenilestaño, y acetato de trifenilestaño; y compuestos de cianopirrol tales como fludioxonil y fenpiclonil. Otros compuestos aquí utilizables incluyen ftalida, fluazinam, cimoxanil, triforina, pirifenox, fenarimol, fenpropidin, pencicuron, ciazofamid, iprovalicarb, and bentiavalicarb-isopropil y similares.

De acuerdo con otro aspecto de la presente invención se proporciona el uso de un compuesto representado por la fórmula (Ia) o (Ib) o una sal respectiva agrícola y hortícolamente aceptable como agente de control de plagas. De acuerdo con todavía otro aspecto de la presente invención, se proporciona el uso de un compuesto representado por la fórmula (Ia) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como un agente de control de plagas. De acuerdo con todavía otro aspecto de la presente invención, se proporciona el uso de un compuesto representado por la fórmula (Ib) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como un agente de control de plagas.

[EJEMPLOS]

La presente invención se ilustra adicionalmente mediante los siguientes Ejemplos.

Los números de compuesto corresponden a los números de compuesto de las Tablas 1 a 14.

#### 45 Ejemplo 1: Síntesis del compuesto 73

El compuesto 76 (890 mg) sintetizado con el método descrito en la publicación de patente japonesa abierta al público n.º 259569/1996 se disolvió en una solución de metanol acuosa al 80 %. Después, se añadió 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (216 mg) a la solución y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1,5 h. La mezcla de reacción se añadió con ácido acético para inactivar la reacción y el disolvente se retiró por evaporación a presión reducida. Se añadió agua al cristal precipitado, seguido de extracción con cloroformo. La capa de cloroformo se lavó con salmuera saturada, se secó sobre sulfato magnésico anhidro y el disolvente se retiró por evaporación a presión reducida para dar un producto bruto de compuesto 73. El producto bruto se purificó por cromatografía en gel de sílice (Mega Bond Elut (Varian), acetona : hexano = 1 : 1) para dar el compuesto 73 (451 mg).

55 Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 570 (M+H)<sup>+</sup>

#### Ejemplo 2: Síntesis del compuesto 218

60 El compuesto 102 (30 mg) sintetizado con el método descrito en la publicación de patente japonesa abierta al público n.º 259569/1996 y ácido ciclopropanocarboxílico (112 mg) se disolvió en N,N-dimetilformamida anhidra (2 ml) y se añadió a la solución clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida (76 mg) y 4-(dimetilamino)piridina (32 mg). Se agitó la solución de reacción a temperatura ambiente durante 68 horas y luego se vertió en agua, seguido de extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase de acetato de etilo con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 218. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sub>254</sub> 0,5 mm, acetona : hexano = 1 : 1) para dar el compuesto 218 (33 mg).



Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 662(M+H)<sup>+</sup>

Ejemplo 3: Síntesis del compuesto 261

5 Se disolvió el compuesto 218 (1,07 g) preparado en el ejemplo 1 en una solución de metanol acuosa al 80%. Se añadió a la solución 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-undeca-7-eno (271 mg) y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 24,5 horas. Se añadió la mezcla de reacción con ácido acético para enfriar la reacción y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida. Se añadió agua al cristal precipitado, seguido de extracción con cloroformo. Se lavó la fase de cloroformo con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 261. Se purificó el producto bruto mediante cromatografía sobre gel de sílice (Mega Bond Elut (Varian), acetona:hexano = 1:1) para dar el compuesto 261 (233 mg).  
10 Datos espectrométricos de masa (ESI<sup>+</sup>): 594 (M+H)<sup>+</sup>

15 Ejemplo 4: Síntesis del compuesto 222

El compuesto 73 (30 mg) preparado en el Ejemplo 1 y ácido 4-(trifluorometil)nicotínico (30 mg) se disolvió en N,N-dimetilformamida anhidra (3 ml). Después, se añadieron a la solución clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida (15 mg) y 4-(dimetilamino)piridina (4 mg) y la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 15 horas y después se vertió en agua, seguido de extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase de acetato de etilo con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 222. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sub>254</sub> 0,5 mm, acetona : hexano = 1 : 1) para dar el compuesto 222 (19 mg).  
20 Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 743(M+H)<sup>+</sup>

Ejemplo 5: Síntesis del compuesto 269

30 Se disolvió el compuesto 261 (20 mg) preparado en el Ejemplo 3 y ácido 2-cianobenzoico (30 mg) en N,N-dimetilformamida anhidra (1 ml), y se añadió a la solución clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida (26 mg) y 4-(dimetilamino)piridina (4 mg). Se agitó la solución de reacción a temperatura ambiente durante 12 horas y se añadió la solución de reacción a agua, seguido de extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase de acetato de etilo con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 269. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sup>254</sup> 0,5 mm, acetona: hexano = 1:1) para dar el compuesto 269 (18 mg).  
35 Datos espectrométricos de masa (ESI<sup>+</sup>): 723 (M+H)<sup>+</sup>

Ejemplo 6: Síntesis del compuesto de referencia 225

40 1,7,11-Tridesacetil-13-oxo-6''-colopiripropeno A (10 mg) descrito en Journal of Antibiotics (1997), 50 (3), 229-36 se disolvió en N,N-dimetilformamida anhidra (1 ml). Se añadieron a la solución trietilamina (24 mg) y 4-(dimetilamino)piridina (0,5 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 min. En lo sucesivo, se añadió ácido propiónico anhidro (8 mg). La solución de reacción se añadió a agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase de acetato de etilo con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 225. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sub>254</sub> 0,5 mm, acetona : hexano = 1 : 1) para dar el compuesto 225 (5,6 mg).  
45 Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 658(M+H)<sup>+</sup>

50

Ejemplo 7: Síntesis del compuesto 226

55 El compuesto 225 (10 mg) preparado en el Ejemplo 6 se disolvió en metanol (1 ml). Después, se añadieron a la solución heptahidrato de cloruro de cerio (III) (57 mg) y borohidruro de sodio (6 mg). La mezcla se agitó a 0 °C durante 7 horas y después se añadió agua a la solución de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo. Se lavó la fase de acetato de etilo con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 226. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sub>254</sub> 0,5 mm, acetona : hexano = 1 : 1) para dar el compuesto 226 (8,5 mg).  
60 Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 660 (M+H)<sup>+</sup>

Ejemplo 8: Síntesis del compuesto de referencia 273

65 1,7,11-Tridesacetil-1,11-o-p-metoxibenciliden-piripropeno A (10 mg) descrito en la publicación de patente japonesa abierta al público n.º 259065/1996 se disolvió en diclorometano anhidro (0,5 ml) y se añadió a la solución dicromato

- de piridinio (PDC) (39 mg). La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas y la solución de reacción se añadió a agua. La capa de diclorometano se lavó con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 273. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sub>254</sub> 0,5 mm, cloroformo : metanol = 12,5 : 1) para dar el compuesto 273 (4,4 mg).  
5 Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 574 (M+H)<sup>+</sup>

Ejemplo 9: Síntesis del compuesto de referencia 274

- 10 1,7,11-o-Carbonato cíclico-1,7,11-tridesacetil-piripiropeno A (4 mg) descrito en la publicación de patente japonesa abierta al público n.º 259065/1996 se disolvió en diclorometano anhidro (1 ml). Se añadieron a la solución trietilamina (5 µl) y 4-(dimetilamino)piridina (1 mg). La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 min y se añadió a la misma anhídrido de ácido valérico (5 µl). Después, la solución de reacción se agitó a temperatura  
15 ambiente durante 3 h. La solución de reacción se añadió a agua, y la capa de diclorometano se lavó con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se separó el disolvente mediante evaporación bajo presión reducida para dar un producto bruto del compuesto 274. El producto bruto se purificó mediante cromatografía de capa fina preparativa (Gel de sílice Merck 60 F<sub>254</sub> 0,5 mm, cloroformo : metanol = 25 : 1) para dar el compuesto 274 (0,1 mg).  
20 Datos espectrométricos de masa (FAB<sup>+</sup>): 652 (M+H)<sup>+</sup>

Ejemplo 10

- Los compuestos mostrados en las Tablas 15 a 17 se sintetizaron usando materiales de partida, reactivos de  
25 reacción 1 y 2 y disolventes descritos en estas tablas. Además, los datos de RMN-<sup>1</sup>H sobre algunos de los compuestos en las Tablas 15 a 17 se describió en las Tablas 18 a 29. Además, el CDCl<sub>3</sub> se usó como el disolvente para la medición de RMN-<sup>1</sup>H. El etrametilsilano se usó como una sustancia patrón para la medición de RMN-<sup>1</sup>H.

- Como observación, los compuestos 206, 207, 210, 215, 220, 23, 224, 230, 231, 235, 236 y 238 en las tablas 15 y 16  
30 son compuestos de referencia.

Tabla 15

N.º de compuesto	Material de partida (N.º de compuesto)	Cantidad	Reactivo de reacción 1	Cantidad	Reactivo de reacción 2	Disolvente	Rendimiento	Datos de espectrometría de masas	
								Método de medición	Datos
74	73	30 mg	Anhídrido acético	32,7 mg	Et <sub>3</sub> N 64,0 mg, DMAP 12,8 mg	DMF	13,6 mg	FAB	612 (M+H) <sup>+</sup>
77	73	30 mg	Ácido benzoico	84,8 mg	EDC 149,2 mg, DMAP 46,4 mg	DMF	36,4 mg	FAB	674 (M+H) <sup>+</sup>
91	102	30 mg	Anhídrido piválico	220 mg	Et <sub>3</sub> N 60,0 mg, DMAP 8,0 mg	DMF	27,7 mg	FAB	710 (M+H) <sup>+</sup>
205	73	30 mg	Ácido nicotínico	12,9 mg	EDC 115,1 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	27,1 mg	FAB	675 (M+H) <sup>+</sup>
206	73	30 mg	Anhídrido isobutírico	50,0 mg	Et <sub>3</sub> N 64,0 mg, DMAP 12,8 mg	DMF	11,4 mg	FAB	640 (M+H) <sup>+</sup>
207	73	30 mg	Anhídrido piválico	58,9 mg	Et <sub>3</sub> N 64,0 mg, DMAP 12,8 mg	DMF	23,4 mg	FAB	654 (M+H) <sup>+</sup>
208	73	30 mg	Anhídrido 4-(trifluorometil)benzoico	114 mg	Et <sub>3</sub> N 64,0 mg, DMAP 12,8 mg	DMF	32,2 mg	FAB	742 (M+H) <sup>+</sup>
209	73	40 mg	1,1-carbonildimidazol	34,0 mg	-----	tolueno	5,1 mg	FAB	664 (M+H) <sup>+</sup>
210	73	30 mg	Isocianato de propilo	26,9 mg	Et <sub>3</sub> N 64,0 mg, DMAP 12,8 mg	DMF	3,2 mg	FAB	655 (M+H) <sup>+</sup>
211	73	30 mg	3,4-dihidro-2H-pirano	155 mg	Clorhidrato de piridina	CH <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub>	22,7 mg	FAB	654 (M+H) <sup>+</sup>
212	73	30 mg	Ácido 6-cloro nicotínico	16,5 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	39,8 mg	FAB	709 (M+H) <sup>+</sup>
213	73	30 mg	Ácido ciclopropan carboxílico	27 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	18,2 mg	FAB	638 (M+H) <sup>+</sup>
214	73	30 mg	Ácido ciclobutan carboxílico	31 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	14,9 mg	FAB	652 (M+H) <sup>+</sup>
215	73	30 mg	Ácido acrílico	22,5 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	5,6 mg	FAB	624 (M+H) <sup>+</sup>
216	73	30 mg	Ácido isonicotínico	12,9 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	8,2 mg	FAB	675 (M+H) <sup>+</sup>

N.º de compuesto	Material de partida (N.º de compuesto)	Cantidad	Reactivo de reacción 1	Cantidad	Reactivo de reacción 2	Disolvente	Rendimiento	Datos de espectrometría de masas	
								Método de medición	Datos
217	73	30 mg	Ácido picolínico	12,9 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	40,6 mg	FAB	675 (M+H) <sup>+</sup>
219	102	30 mg	Ácido ciclobutan carboxílico	131 mg	EDC 176 mg, DMAP 32 mg	DMF	38,9 mg	FAB	704 (M+H) <sup>+</sup>
220	102	30 mg	Ácido benzoico	160 mg	EDC 1126 mg, DMAP 80 mg	DMF	37,9 mg	FAB	770 (M+H) <sup>+</sup>
221	73	30 mg	Ácido 6-(trifluorometil)nicotínico	30 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	35,4 mg	FAB	743 (M+H) <sup>+</sup>
223	102	30 mg	Ácido 3,3,3-trifluoropropiónico	168 mg	EDC 1126 mg, DMAP 80 mg	DMF	10,4 mg	FAB	788 (M+H) <sup>+</sup>
224	73	30 mg	Ácido 3,3,3-trifluoropropiónico	20 mg	EDC 115,2 mg, DMAP 6,4 mg	DMF	8,0 mg	FAB	680 (M+H) <sup>+</sup>

Tabla 16

N.º de compuesto	Material de partida (N.º de compuesto)	Cantidad	Reactivo de reacción 1	Cantidad	Reactivo de reacción 2	Disolvente	Rendimiento	Datos de espectrometría de masas	
								Método de medición	Datos
227	73	20 mg	Ácido 3-fluoro-isonicotínico	15 mg	ED C114 mg, DMAP4 mg	DMF	5,4 mg	FAB	693 (M+H) <sup>+</sup>
228	73	20 mg	Ácido 3-cloro-isonicotínico	17 mg	ED C114 mg, DMAP4 mg	DMF	7,8 mg	FAB	709 (M+H) <sup>+</sup>
229	73	20 mg	Ácido 3-metilpicolinico	14 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	16,7 mg	FAB	689 (M+H) <sup>+</sup>
230	73	20 mg	Ácido 3-benzoil-2-piridin carboxílico	48 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	16,4 mg	FAB	779 (M+H) <sup>+</sup>
231	73	20 mg	Ácido 3-n-propoxi picolinico	38 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	17,3 mg	FAB	733 (M+H) <sup>+</sup>
232	73	20 mg	ácido 6-fluoro nicotínico	30 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	5,3 mg	FAB	693 (M+H) <sup>+</sup>
233	102	20 mg	Ácido ciclopentan carboxílico	99 mg	EDCI84 mg, DMAP5 mg	DMF	28,3 mg	FAB	746 (M+H) <sup>+</sup>
234	102	20 mg	Ácido ciclohexan carboxílico	112 mg	EDCI84 mg, DMAP5 mg	DMF	21,5 mg	FAB	788 (M+H) <sup>+</sup>
235	102	20 mg	Ácido cianoacético	74 mg	EDCI84 mg, DMAP5 mg	DMF	3,3 mg	FAB	659 (M+H) <sup>+</sup>
236	102	20 mg	Ácido ciclopropilacético	87 mg	EDCI84 mg, DMAP5 mg	DMF	16,7 mg	FAB	786 (M+H) <sup>+</sup>
237	102	20 mg	Ácido ciclopropilacético	87 mg	EDCI84 mg, DMAP5 mg	DMF	8,2 mg	FAB	704 (M+H) <sup>+</sup>
238	102	20 mg	Ácido 2,2-difluoro-1-metilciclopropanocarboxílico	118 mg	EDCI84 mg, DMAP5 mg	DMF	6,1 mg	FAB	812 (M+H) <sup>+</sup>
239	73	20 mg	Ácido 4-metilnicotínico	36 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	16,1 mg	FAB	689 (M+H) <sup>+</sup>
240	73	20 mg	Ácido 4-cloronicotínico	33 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	13,8 mg	FAB	709 (M+H) <sup>+</sup>
241	73	20 mg	Ácido (4-metoxi carbonil) nicotínico	38 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	18,8 mg	FAB	733 (M+H) <sup>+</sup>

N.º de compuesto	Material de partida (N.º de compuesto)	Cantidad	Reactivo de reacción 1	Cantidad	Reactivo de reacción 2	Disolvente	Rendimiento	Datos de espectrometría de masas	
								Método de medición	Datos
242	73	20 mg	Ácido 5-(trifluorometil)ieno[3,2-b]-piridin-6-carboxílico	38 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	20,3 mg	FAB	799 (M+H) <sup>+</sup>
243	73	20 mg	Ácido 2-cianobenzoico	31 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	6,6 mg	FAB	699 (M+H) <sup>+</sup>
244	73	20 mg	Ácido 2-(trifluorometil)benzoico	40 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	10,2 mg	FAB	742 (M+H) <sup>+</sup>
245	73	20 mg	Ácido 2-fluorobenzoico	29 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	16,1 mg	FAB	692 (M+H) <sup>+</sup>
246	73	20 mg	Ácido 2-nitrobenzoico	35 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	9,8 mg	FAB	719 (M+H) <sup>+</sup>
247	73	20 mg	Ácido 2-clorobenzoico	33 mg	EDCI28 mg, DMAP 8 mg	DMF	13,1 mg	FAB	709 (M+H) <sup>+</sup>

Tabla 17

N.º de compuesto	Material de partida (N.º de compuesto)	Cantidad	Reactivo de reacción 1	Cantidad	Reactivo de reacción 2	Disolvente	Rendimiento	Datos de espectrometría de masas	
								Método de medición	Datos
248	73	20 mg	Ácido 2-cloro-6-metilnicotínico	36 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	17,2 mg	FAB	723 (M+H) <sup>+</sup>
249	73	20 mg	Metoximetilbromuro	31 mg	[<DH3)2CH]2NEt 18 mg	DMF	1,2 mg	ESI	614 (M+H) <sup>+</sup>
250	102	20 mg	Ácido 2,2-difluorociclopropanocarboxílico	106 mg	EDC184 mg, DMAP 5 mg	DMF	23,2 mg	ESI	770 (M+H) <sup>+</sup>
251	73	20 mg	3-terc-butiltio-2-carboxi piridina	44 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	7,6 mg	ESI	763 (M+H) <sup>+</sup>
252	73	20 mg	Ácido 3,5-difluoropiridin-2-carboxílico	33 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	10,9 mg	ESI	711 (M+H) <sup>+</sup>
253	73	20 mg	Ácido pirazincarboxílico	26 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	10,9 mg	ESI	676 (M+H) <sup>+</sup>
254	73	20 mg	Ácido 4-tiazolcarboxílico	27 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	18,5 mg	ESI	681 (M+H) <sup>+</sup>
255	73	20 mg	Ácido 4-tiazol carboxílico	34 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	15,8 mg	ESI	714 (M+H) <sup>+</sup>
256	73	20 mg	Ácido 3-cloro tiofen-2-carboxílico	29 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	15,1 mg	ESI	689 (M+H) <sup>+</sup>
257	73	20 mg	Ácido 6-cloro piridin-2-carboxílico	33 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	12,7 mg	ESI	709 (M+H) <sup>+</sup>
258	73	20 mg	Ácido 6-fluoro piridin-2-carboxílico	30 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	14,4 mg	ESI	693 (M+H) <sup>+</sup>
259	73	20 mg	Ácido 1-metil indol-2-carboxílico	37 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	18,8 mg	ESI	727 (M+H) <sup>+</sup>
260	73	20 mg	Ácido 3-cloropiridin-2-carboxílico	33 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	14,6 mg	ESI	709 (M+H) <sup>+</sup>
262	73	20 mg	Ácido 2-fluoro nicotínico	30 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	9,9 mg	ESI	693 (M+H) <sup>+</sup>
263	73	20 mg	Ácido 4-ciano benzoico	31 mg	ED C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	14,0 mg	ESI	699 (M+H) <sup>+</sup>

N.º de compuesto	Material de partida (N.º de compuesto)	Cantidad	Reactivo de reacción 1	Cantidad	Reactivo de reacción 2	Disolvente	Rendimiento	Datos de espectrometría de masas	
								Método de medición	Datos
264	73	20 mg	Ácido 3-ciano benzoico	31 mg	E D C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	16,9 mg	ESI	699 (M+H) <sup>+</sup>
265	73	20 mg	Ácido 3-(trifluorometil)benzoico	40 mg	E D C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	14,3 mg	ESI	742 (M+H) <sup>+</sup>
266	73	20 mg	Ácido 2-piridilacético	36 mg	E D C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	11,7 mg	ESI	689 (M+H) <sup>+</sup>
267	73	20 mg	Ácido 3-piridilacético	36 mg	E D C-128 mg, DMAP 8 mg	DMF	8,6 mg	ESI	689 (M+H) <sup>+</sup>
268	73	20 mg	Ácido (4-piridil) acético	36 mg	E D C-128 mg, DMAP 4 mg	DMF	16,5 mg	ESI	721 (M+H) <sup>+</sup>
270	261	20 mg	Ácido 4-(trifluorometil)nicotínico	39 mg	EDC/26mg, DMAP 4 mg	DMF	8,3 mg	ESI	767 (M+H) <sup>+</sup>
271	261	20 mg	Ácido 3-cloropiridin-2-carboxílico	32 mg	EDC/26mg, DMAP 4 mg	DMF	14,5 mg	ESI	733 (M+H) <sup>+</sup>



[Tabla 18]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
73	0,91 (1H, s), 1,13 (3H,t J = 5,1 Hz), 1,14 0H,t J = 5,1 Hz), 1,26 (1H,s), 1,32-1,40 (1H,m), 1,42 (3H,s), 1,45 (1H, d, J = 2,7 Hz), 1,49-1,51 (2H,m), 1,66 (3H, s), 1,81-1,91 (2H,m), 2,13-2,18 (1H, m), 2,24-2,37 (4H,m), 2,90 (1H, m), 3,79 (3H, m), 4,80 (1H, dd, J = 3,5, 7,6 H z), 4,99-5,00 (1H, m), 6,52 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 3,5, 5,4 H z), 8,11 (1H, dt J = 1,4, 5,4 H z), 8,70 (1H, d, J = 2,4 Hz), 9,00 (1H, s)
77	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,37-1,46 (1H, m), 1,51 (3H,s),1,62 (1H, d, J = 3,8 Hz), 1,68-1,82 (3H, m), 1,87 (3H, s), 1,91 -2,00 (3H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,33 (3H, q, J = 7,6 H z), 2,43 (3H, dq, J = 1,4, 7,6 H z), 2,97 (1H, s), 3,70 (1H, d, J = 11,9 H z), 3,84 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 5,1, 11,1 Hz), 5,05 (1H,d, J = 4,3 H z), 5,27 (1H, dd, J = 4,6, 11,1 H z), 6,45 (1H, s), 7,39-7,66 (4H, m), 8,05- 8,13 (3H,m), 8,70 (1H, d, J = 4,6 Hz), 9,00 (1H,s)
74	0,90 (3H, s), 1,12 (3H, t J = 7,8 Hz), 1,13 (3H, t J = 7,8 Hz), 1,19 (1H, s), 1,25-1,34 (1H, m), 1,44 (3H, s), 1,53-1,63 (3H, m), 1,69 (3H, s), 1,73-1,90 (3H,m), 2,10 (1H,m), 2,16 (3H,s), 2,33 (3H, dq, J = 2,4, 7,6 Hz), 2,36 (3H, dq, J = 3,2, 7,6 H z), 2,87 (1H, m), 3,72 (3H, m), 4,81 (1H, dd, J = 4,6,11,6 Hz), 4,97-5,00 (3H,m), 6,46 (1H,s), 7,40 (1H, dd, J = 4,6, 8,1 Hz), 8,10 (1H,m), 8,69 (1H, d, J = 4,9 Hz), 9,00 (1H, s)
205	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,42-1,50 (1H, m), 1,59 (3H, s), 1,61 -1,83 (3H, m), 1,85 (3H, s), 1,83-2,00 (3H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,33 (3H, q, J = 7,6 H z), 2,43 (3H, q, J = 7,6 Hz), 2,94 (1H, m), 3,72 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,82 (1H, d, J = 12,7 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9,11,3 Hz), 5,03-5,06 (1H,m), 5,27 (1H, dd, J = 4,9, 1,3 Hz), 6,42 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,45 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 H z), 8,07 (1H, dt J = 2,2, 8,1 H z), 8,36 (1H, dt J = 1,9, 8,1 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,9, 5,1 Hz), 8,83 (1H, dd, J = 1,9, 4,9 Hz), 8,97 (1H, d, J = 1,9 Hz), 9,30 (1H, d, J = 1,9 Hz)
206	0,90 (3H,s), 1,13 (6H, t J = 7,6 Hz), 1,19 (1H,s), 1,24 (3H, d, J = 4,6 Hz), 1,26 (3H, d, J = 4,6 Hz), 1,33-1,38 (1H,m), 1,45 (3H,s), 1,54 (1H,d, J = 3,8 H z), 1,60-1,64 (3H, m), 1,67 (3H, s), 1,75-1,90 (3H, m), 2,15-2,19 (1H, m), 2,32 (3H, q, J = 7,6 Hz), 2,38 (3H, q, J = 7,6 Hz), 2,65 (1H,quht, J = 7,6 Hz), 2,88 (1H, d, J = 1,6 Hz), 3,68 (1H, d, J = 12,4 Hz), 3,83 (1H,d, J = 11,9 Hz), 4,80 (1H, dd, J = 4,9,11,3 Hz), 5,00 (3H, m), 6,38 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J =4,6, 8,1 Hz), 8,09 (IH, dt J = 1,9, 8,1 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 1,6, 4,6 Hz), 9,00 (1H, d, J = 1,6 Hz)

[Tabla 19]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
208	0,92 (3H, s), 1,14 C3H, t, J = 7,6 Hz), 1,21 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,47 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,61 (1H, m), 1,68-1,83 (2H, m), 1,86 (3H,s), 1,91-2,05 (2H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,43 (2H, dq, J = 1,4, 7,6 Hz), 2,95 (1H, d, J = 2,4 Hz), 3,72 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,82 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 5,1, 11,1 Hz), 5,03-5,06 (1H, m), 5,26 (1H, dd, J = 4,9, 11,1 Hz), 6,40 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,4 Hz), 7,76 (2H, d, J = 8,4 Hz), 8,06 (1H, dt, J = 2,2, 8,1 Hz), 8,22 (2H, d, J = 8,4 Hz), 8,66 (1H, dd, J = 1,6, 4,9 Hz), 8,96 (1H, d, J = 2,2 Hz)
211	0,90 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,15 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,29-1,38 (1H, m), 1,41 (3H, s), 1,43-1,71 (5H, m), 1,59 (3H, s), 1,75-1,89 (6H, m), 2,12-2,17 (1H, m), 2,26-2,38 (4H, m), 2,86 (1H, m), 3,45-4,00 (5H, m), 4,82 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 4,97-5,03 (2H, m), 6,41 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,9, 7,8 Hz), 8,07-8,13 (1H, m), 8,67-8,70 (1H, m), 9,01 (1H, d, J = 2,4 Hz)
212	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,46 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,61 (1H, m), 1,66-1,78 (2H, m), 1,84 (3H, s), 1,87-1,99 (2H, m), 2,12-2,23 (1H, m), 2,31 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,41 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,95 (1H, m), 3,73 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,3 Hz), 5,04 (1H, m), 5,25 (1H, dd, J = 4,9, 1,3 Hz), 6,40 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,6, 7,8 Hz), 7,47 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,06 (1H, dt, J = 1,6, 7,8 Hz), 8,30 (1H, dd, J = 2,4, 8,1 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,4, 4,6 Hz), 8,97 (1H, d, J = 2,4 Hz), 9,06 (1H, d, J = 2,7 Hz)
213	0,90 (3H, s), 0,93 (2H, d, J = 2,7 Hz), 0,96 (2H, d, J = 2,7 Hz), 1,03-1,19 (6H, m), 1,26 (1H, s), 1,32-1,39 (1H, m), 1,45 (3H, s), 1,52 (1H, d, J = 3,8 Hz), 1,61-1,69 (3H, m), 1,71 (3H,s), 1,73-1,94 (2H, m), 2,14-2,19 (1H, m), 2,24-2,40 (4H, m), 2,95 (1H, m), 3,68 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,79 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 4,96-5,00 (2H, m), 6,45 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,6, 8,1 Hz), 8,10 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,68 (1H, m), 9,01 (1H, m)
214	0,90 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,17 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,34-1,40 (1H, m), 1,44 (3H, s), 1,54 (1H, d, J = 4,3 Hz), 1,61-1,67 (2H, m), 1,69 (3H,s), 1,72-2,42 (13H, m), 2,91 (1H, m), 3,23 (1H, quint, J = 8,1 Hz), 3,69 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,80 (1H, dd, J = 4,9, 11,3 Hz), 4,99-5,04 (2H, m), 6,40 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,09 (1H, dt, J = 1,6, 8,1 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 1,6, 4,6 Hz), 9,01 (1H, d, J = 1,6 Hz)
215	0,90 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,17 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,41-1,46 (1H, m), 1,59 (3H, s), 1,65-1,68 (3H, m), 1,73 (3H, s), 1,84-1,90 (2H, m), 2,18 (1H, m), 2,31 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,38 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,93 (1H, m), 3,69 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,80(1H, m), 5,01-5,09 (2H, m), 5,92 (1H, dd, J = 1,6, 10,5 Hz), 6,15-6,24 (1H, m), 6,45 (1H, s), 6,45-6,53 (1H, m), 7,40 (1H, dd, J = 4,6, 7,8 Hz), 8,07-8,11 (1H, m), 8,68 (1H, dd, J = 1,9, 4,9 Hz), 9,00 (1H, d, J = 2,2 Hz)

[Tabla 20]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
216	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,42 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,64-1,78 (3H, m), 1,85 (3H, s), 1,88-2,05 (2H, m), 2,17-2,23 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 1,1, 7,6 Hz), 2,99 (1H, m), 3,72 (1H, d, J = 12,4 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,5 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,5 Hz), 5,03-5,05 (1H, m), 5,25 (1H, dd, J = 5,4, 1,5 Hz), 6,41 (1H, s), 7,37 (1H, dd, J = 5,2, 8,1 Hz), 7,91 (2H, dd, J = 1,6, 4,6 Hz), 8,07 (1H, dt, J = 1,6, 8,1 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,9, 4,9 Hz), 8,83 (2H, dd, J = 1,6, 4,3 Hz), 8,97 (1H, d, J = 1,6 Hz)
217	0,91 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,37-1,46 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,63-1,75 (3H, m), 1,87 (3H, s), 1,83-1,96 (2H, m), 2,13-2,23 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 1,4, 7,6 Hz), 2,99 (1H, m), 3,67 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 4,98-5,06 (1H, m), 5,38 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 6,43 (1H, s), 7,35-7,44 (1H, m), 7,50-7,55 (1H, m), 7,89 (1H, dt, J = 1,6, 7,6 Hz), 8,07 (1H, dt, J = 1,6, 8,1 Hz), 8,18 (1H, d, J = 7,6 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,6, 4,9 Hz), 8,82-8,84 (1H, m), 8,97 (1H, d, J = 2,4 Hz)
218	0,83-1,12 (12H, m), 0,91 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,33-1,41 (1H, m), 1,45 (3H, s), 1,52-1,69 (6H, m), 1,71 (3H, s), 1,81-1,93 (2H, m), 2,14-2,18 (1H, m), 2,92 (1H, m), 3,72 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,82 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,80 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 4,99-5,04 (2H, m), 6,46 (1H, s), 7,41 (1H, dd, J = 4,9, 8,3 Hz), 8,10 (1H, dt, J = 1,7, 8,3 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 9,01 (1H, d, J = 1,4 Hz)
219	0,90 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,32-1,41 (1H, m), 1,44 (3H, s), 1,51-1,63 (3H, m), 1,69 (3H, s), 1,79-2,04 (8H, m), 2,17-2,40 (14H, m), 2,89 (1H, m), 3,08-3,26 (3H, m), 3,67 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,78 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,79 (1H, dd, J = 5,4, 11,1 Hz), 4,97-5,00 (2H, m), 6,41 (1H, s), 7,41 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,09 (1H, dt, J = 1,9, 8,4 Hz), 8,68 (1H, m), 9,00 (1H, m)
220	1,17 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,57 (3H, s), 1,65 (1H, m), 1,77-1,82 (2H, m), 1,88 (3H, s), 1,94-2,05 (3H, m), 2,13-2,31 (1H, m), 2,95 (1H, m), 4,16 (2H, s), 5,06 (1H, dd, J = 2,4, 6,5 Hz), 5,17-5,32 (2H, m), 6,42 (1H, s), 7,34-7,64 (10H, m), 8,01-8,12 (7H, m), 8,66 (1H, dd, J = 1,6, 5,1 Hz), 8,97 (1H, d, J = 1,9 Hz)
221	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,21 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,44 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,57-1,62 (1H, m), 1,67-1,80 (2H, m), 1,85 (3H, s), 1,91-1,95 (2H, m), 2,17-2,24 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,92 (1H, m), 3,74 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,1 Hz), 5,04 (1H, m), 5,27 (1H, dd, J = 4,9, 1,1 Hz), 6,40 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,84 (1H, d, J = 8,4 Hz), 8,05-8,08 (1H, m), 8,54 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,67 (1H, d, J = 4,6 Hz), 8,96 (1H, d, J = 2,2 Hz), 9,38 (1H, s)

[Tabla 21]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
222	0,94 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,47 (1H, m), 1,48 (3H, s), 1,57-1,71 (3H, m), 1,75 (3H, s), 1,83-1,97 (2H, m), 2,10-2,22 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 1,6, 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,74-3,80 (2H, m), 4,83 (1H, dd, J = 5,7, 11,6 Hz), 5,02-5,03 (1H, m), 5,28 (1H, dd, J = 5,4, 11,6 Hz), 6,41 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 5,4, 7,6 Hz), 7,69 (1H, d, J = 5,4 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 2,2, 8,1 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 1,6, 4,9 Hz), 8,97 (1H, d, J = 4,6 Hz), 9,00 (1H, d, J = 2,4 Hz), 9,16 (1H, s)
223	0,94 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,37 (1H, m), 1,47 (3H, s), 1,48-1,66 (3H, m), 1,71 (3H, s), 1,75-1,96 (2H, m), 2,17-2,24 (1H, m), 2,96 (1H, m), 3,14-3,35 (6H, m), 3,85 (1H, d, J = 12,2 Hz), 3,93 (1H, d, J = 12,2 Hz), 4,87 (1H, dd, J = 5,7, 10,8 Hz), 4,99-5,08 (2H, m), 6,41 (1H, s), 7,41 (1H, dd, J = 4,6, 8,1 Hz), 8,09 (1H, m), 8,69 (1H, m), 9,02 (1H, m)
224	0,91 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,3 Hz), 1,17 (3H, t, J = 7,3 Hz), 1,26 (1H, s), 1,40 (1H, m), 1,45 (3H, s), 1,58-1,63 (3H, m), 1,70 (3H, s), 1,73-1,89 (2H, m), 2,10-2,18 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,36 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,25 (1H, d, J = 9,7 Hz), 3,32 (1H, d, J = 9,7 Hz), 3,69-3,81 (2H, m), 4,80 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 5,00-5,08 (2H, m), 6,40 (1H, s), 7,41 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,09 (1H, m), 8,69 (1H, dd, J = 1,4, 5,1 Hz), 9,01 (1H, d, J = 2,4 Hz)
225	0,88 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,22 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,24 (3H, s), 1,26 (1H, m), 1,50-1,55 (1H, m), 1,56 (3H, s), 1,55-1,64 (3H, m), 1,70-1,84 (2H, m), 2,31 (2H, dq, J = 1,2, 7,8 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 3,4, 13,6 Hz), 2,44 (2H, dq, J = 2,0, 7,5 Hz), 2,79 (1H, dt, J = 1,4, 5,1 Hz), 3,69 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,79 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,79 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 5,24 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 6,45 (1H, s), 7,47 (1H, d, J = 8,5 Hz), 8,12 (1H, dd, J = 2,7, 8,5 Hz), 8,83 (1H, d, J = 2,7 Hz)
226	0,89 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,10-1,24 (3H, m), 1,26 (1H, s), 1,31-1,39 (1H, m), 1,44 (3H, s), 1,53 (1H, d, J = 3,8 Hz), 1,61-1,67 (2H, m), 1,69 (3H, s), 1,72-1,92 (2H, m), 2,08-2,18 (1H, m), 2,31 (2H, dq, J = 2,7, 7,6 Hz), 2,44 (2H, dq, J = 1,6, 7,6 Hz), 2,26-2,64 (2H, m), 2,85 (1H, s), 3,69 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,80 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,80 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 4,92-5,10 (2H, m), 6,41 (1H, s), 7,44 (1H, d, J = 8,4 Hz), 8,05 (1H, dd, J = 2,4, 8,4 Hz), 8,78 (1H, d, J = 2,4 Hz)
227	0,88 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,23-1,33 (1H, m), 1,43 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61-1,74 (3H, m), 1,82 (3H, s), 1,87-2,23 (3H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,73 (1H, d, J = 12,4 Hz), 3,82 (1H, d, J = 12,4 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 5,03

	(1H, m), 5,26 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 6,43 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,86 (1H, t, J = 5,4 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,9, 7,8 Hz), 8,60 (1H, d, J = 2,2 Hz), 8,66-8,68 (2H, m), 8,98 (1H, d, J = 2,2 Hz)
--	---

[Tabla 22]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
228	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,32-1,44 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 4,1 Hz), 1,67-1,75 (2H, m), 1,81 (3H, s), 1,79-2,05 (2H, m), 2,13-2,22 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 1,4, 7,6 Hz), 2,92 (1H, m), 3,74 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,82 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 5,04 (1H, m), 5,27 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 6,43 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,74 (1H, d, J = 5,1 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 2,2, 8,1 Hz), 8,65 (1H, d, J = 4,9 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 4,1, 7,6 Hz), 8,78 (1H, s), 8,99 (1H, d, J = 1,9 Hz)
229	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 6,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,34-1,45 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,62 (1H, m), 1,71-1,77 (2H, m), 1,83 (3H, s), 1,88-2,01 (2H, m), 2,14-2,22 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,2, 7,6 Hz), 2,64 (3H, s), 2,96 (1H, m), 3,72 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,84 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 5,04 (1H, m), 5,36 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 6,42 (1H, s), 7,35-7,42 (2H, m), 7,66 (1H, d, J = 7,8 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,9, 7,8 Hz), 8,60 (1H, d, J = 4,1 Hz), 8,68 (1H, dd, J = 1,6, 4,9 Hz), 8,98 (1H, d, J = 2,4 Hz)
230	0,78 (3H, s), 1,09 (3H, t, J = 7,8 Hz), 1,12 (3H, t, J = 7,8 Hz), 1,26 (1H, s), 1,33 (3H, s), 1,36-1,38 (1H, m), 1,40-1,48 (2H, m), 1,55 (3H, s), 1,59-1,85 (2H, m), 2,09-2,18 (1H, m), 2,32 (4H, q, J = 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,40 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,75 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,72 (1H, dd, J = 4,9, 11,3 Hz), 4,95 (1H, m), 5,17 (1H, dd, J = 5,4, 11,9 Hz), 6,45 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,49-7,67 (3H, m), 7,83-7,88 (4H, m), 8,02 (1H, s), 8,07 (1H, dt, J = 2,2, 8,1 Hz), 8,68 (1H, dd, J = 1,4, 4,6 Hz), 8,95 (1H, dd, J = 1,6, 4,6 Hz), 8,99 (1H, d, J = 1,9 Hz)
231	0,91 (3H, s), 1,09 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,18 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,34-1,43 (1H, m), 1,48 (3H, s), 1,63 (1H, m), 1,67-1,75 (2H, m), 1,80 (3H, s), 1,83-2,08 (4H, m), 2,17-2,25 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,40 (2H, dq, J = 7,6, 1,9 Hz), 2,96 (1H, m), 3,64 (1H, d, J = 1,9 Hz), 3,87 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,05 (2H, t, J = 6,2 Hz), 4,82 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 5,04 (1H, m), 5,40 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 6,47 (1H, s), 7,19-7,44 (3H, m), 8,08 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,32 (1H, dd, J = 1,6, 4,3 Hz), 8,68 (1H, dd, J = 4,6, 1,6 Hz), 8,98 (1H, d, J = 1,6 Hz)
232	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,34-1,43 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,61 (1H, m), 1,67-1,78 (2H, m), 1,84 (3H, s), 1,87-1,97 (2H, m), 2,13-2,23 (1H, m), 2,18 (1H, s), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 1,4, 7,6 Hz), 3,73 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,80 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 5,4, 11,1 Hz), 5,04 (1H, d, J = 3,8 Hz), 5,25 (1H, dd, J = 5,1, 11,1 Hz), 6,41 (1H, s), 7,06 (1H, dd, J = 3,0, 8,6 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,43-8,50 (1H, m), 8,67 (1H, dd, J = 1,6, 4,6 Hz), 8,95-8,98 (2H, m)

[Tabla 23]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
233	0,91 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,45 (3H, s), 1,70 (3H, s), 1,32-1,97 (29H, m), 2,14-2,19 (1H, m), 2,66-2,90 (3H, m), 3,06 (1H, s), 3,67 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,78 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,78 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 4,98-5,01 (2H, m), 6,40 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,11 (1H, dt, J = 1,6, 8,1 Hz), 8,69 (1H, d, J = 4,6 Hz), 9,01 (1H, s)
234	0,91 (3H, s), 1,45 (3H, s), 1,70 (3H, s), 1,10-2,05 (37H, m), 2,14-2,49 (3H, m), 3,04 (1H, s), 3,65 (1H, d, J = 11,3 Hz), 3,77 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,78 (1H, dd, J = 5,4, 10,8 Hz), 4,97-5,01 (2H, m), 6,41 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,11 (1H, dd, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,69 (1H, d, J = 4,3 Hz), 9,01 (1H, s)
235	1,00 (3H, s), 1,25-1,33 (3H, m), 1,48 (3H, s), 1,55 (1H, m), 1,71 (1H, m), 1,75 (3H, s), 1,79-1,98 (2H, m), 2,11-2,21 (1H, m), 3,48 (2H, s), 3,54 (2H, s), 3,60 (2H, s), 3,90 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,99 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,86 (1H, m), 4,98 (1H, m), 5,07-5,12 (1H, m), 6,53 (1H, s), 7,53 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,23 (1H, m), 8,30 (1H, m), 8,70 (1H, m), 9,05 (1H, m)
236	0,11-0,27 (8H, m), 0,52-0,65 (8H, m), 0,88 (3H, s), 0,99-1,14 (5H, m), 1,15 (3H, s), 1,25-1,43 (2H, m), 1,61-1,76 (4H, m), 1,72 (3H, s), 2,18-2,54 (9H, m), 3,74 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,86 (1H, dd, J = 4,6, 11,6 Hz), 5,01-5,12 (2H, m), 6,41 (1H, s), 7,45 (1H, dd, J = 4,9, 7,8 Hz), 8,16 (1H, m), 8,71 (1H, m), 9,02 (1H, s)
237	0,14-0,26 (6H, m), 0,52-0,64 (6H, m), 0,92 (3H, s), 0,97-1,16 (4H, m), 1,26-1,38 (1H, m), 1,45 (3H, s), 1,52 (1H, m), 1,63-1,70 (2H, m), 1,70 (3H, s), 1,82-1,91 (2H, m), 2,12-2,41 (7H, m), 2,96 (1H, m), 3,74 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,86 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,3 Hz), 5,00-5,03 (2H, m), 6,43 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 4,6, 7,8 Hz), 8,11 (1H, m), 8,70 (1H, d, J = 4,3 Hz), 9,01 (1H, s)
238	0,91 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,44 (3H, s), 1,45 (3H, s), 1,46 (3H, s), 1,34-1,53 (7H, m), 1,52 (3H, s), 1,70 (3H, s), 1,81-2,02 (2H, m), 2,15-2,31 (3H, m), 2,96 (1H, s), 3,67 (1H, m), 4,00 (1H, m), 4,85-5,00 (3H, m), 6,46 (1H, s), 7,45 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,13 (1H, m), 8,70 (1H, m), 9,02 (1H, s)
239	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,33-1,44 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,61 (1H, m), 1,68-1,77 (2H, m), 1,84 (3H, s), 1,91-1,99 (2H, m), 2,17-2,23 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,43 (2H, dq, J = 3,0, 7,6 Hz), 2,69 (3H, s), 2,96 (1H, m), 3,75 (1H, d, J = 12,2 Hz), 3,80 (1H, d,

	J = 12,2 Hz), 4,48 (1H, dd, J = 5,1, 11,1 Hz), 5,04 (1H, d, J = 4,1 Hz), 5,23 (1H, d, J = 5,4, 10,8 Hz), 6,42 (1H, s), 7,24 (1H, d, J = 5,9 Hz), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,08 (1H, d, J = 8,4 Hz), 8,61 (1H, d, J = 5,1 Hz), 8,67 (1H, d, J = 3,5 Hz), 8,98 (1H, s), 9,17 (1H, s)
--	---

[Tabla 24]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
240	3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,9 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,9 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,43 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61 (1H, m), 1,68-1,79 (2H, m), 1,82 (3H, s), 1,88-2,04 (2H, m), 2,17-2,23 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 1,9, 7,6 Hz), 2,96 (1H, s), 3,74 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 1,6, 5,4 Hz), 5,04 (1H, d, J = 4,1 Hz), 5,27 (1H, dd, J = 5,4, 11,6 Hz), 6,43 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,47 (1H, d, J = 5,1 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,68 (1H, dd, J = 1,4, 4,6 Hz), 8,64 (1H, d, J = 5,1 Hz), 8,99 (1H, d, J = 1,9 Hz), 9,14 (1H, s)
241	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,43 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,59 (1H, d, J = 4,4 Hz), 1,66-1,73 (2H, m), 1,78 (3H, s), 1,82-2,05 (2H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,31 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 1,4, 7,6 Hz), 2,96 (1H, s), 3,72 (1H, d, J = 7,6 Hz), 3,81 (1H, d, J = 7,6 Hz), 3,98 (3H, s), 4,84 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 5,04 (1H, m), 5,24 (1H, dd, J = 4,9, 10,8 Hz), 6,54 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,53 (1H, d, J = 4,9 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,68 (1H, d, J = 4,1 Hz), 8,88 (1H, d, J = 4,9 Hz), 9,00 (1H, s), 9,17 (1H, s)
242	0,95 (3H, s), 1,15 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,44 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 4,1 Hz), 1,68-1,72 (2H, m), 1,76 (3H, s), 1,82-2,06 (2H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,34 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,43 (2H, dq, J = 2,2, 7,6 Hz), 2,96 (1H, s), 3,78 (1H, d, J = 12,2 Hz), 3,83 (1H, d, J = 12,2 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 5,4, 11,3 Hz), 5,04 (1H, d, J = 4,1 Hz), 5,2-5,34 (1H, m), 6,40 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J = 5,4 Hz), 8,02-8,11 (2H, m), 8,69 (1H, d, J = 4,3 Hz), 8,74 (1H, s), 9,00 (1H, s)
243	(3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,44 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,62 (1H, m), 1,68-1,75 (2H, m), 1,84 (3H, s), 1,93-1,96 (2H, m), 2,14-2,23 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,4, 7,6 Hz), 2,96 (1H, s), 3,72 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 1,6, 5,4 Hz), 5,04 (1H, m), 5,36 (1H, dd, J = 4,9, 11,3 Hz), 6,46 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 5,4, 7,6 Hz), 7,68-7,78 (2H, m), 7,83-7,88 (1H, m), 8,07 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,19-8,23 (1H, m), 8,67 (1H, dd, J = 1,6, 4,9 Hz), 8,98 (1H, d, J = 2,2 Hz)
244	3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,34-1,43 (1H, m), 1,48 (3H, s), 1,60 (1H, d, J = 4,1 Hz), 1,66-2,02 (4H, m), 1,73 (3H, s), 2,11-2,23 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,2, 7,6 Hz), 2,90 (1H, s), 3,74 (1H, d, J = 11,9 Hz), 5,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,82 (1H, dd, J = 4,9, 11,1 Hz), 5,03 (1H, m), 5,27 (1H, dd, J = 5,1, 11,6 Hz), 6,43 (1H, s), 7,41 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,65-7,70 (2H, m), 7,78-7,86 (2H, m), 8,09 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,69 (1H, d, J = 3,8 Hz), 9,00 (1H, s)

[Tabla 25]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
245	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,46 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,62 (1H, d, J = 4,1 Hz), 1,83 (3H, s), 1,66-2,02 (4H, m), 2,11-2,23 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 1,2, 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 3,2, 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,70 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,85 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,04 (1H, m), 5,27 (1H, dd, J = 5,1, 11,9 Hz), 6,45 (1H, s), 7,18 (1H, dd, J = 8,5, 10,9 Hz), 7,27 (1H, m), 7,38 (1H, dd, J = 4,8, 8,1 Hz), 7,55-7,61 (1H, m), 8,03 (1H, dt, J = 1,7, 7,3 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,7, 8,3 Hz), 8,67 (1H, d, J = 3,9 Hz), 8,98 (1H, s)
246	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,32-1,42 (1H, m), 1,45 (3H, s), 1,59 (1H, d, J = 3,0 Hz), 1,66 (3H, s), 1,69-1,92 (4H, m), 2,02-2,21 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 1,1, 5,1 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,2, 5,1 Hz), 2,96 (1H, m), 3,76 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,84 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,03 (1H, d, J = 4,2 Hz), 5,19 (1H, dd, J = 5,4, 11,7 Hz), 6,60 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 4,6, 8,1 Hz), 7,66-7,76 (2H, m), 7,84 (1H, dd, J = 1,5, 7,5 Hz), 7,93 (1H, dd, J = 1,5, 7,8 Hz), 8,11 (1H, dt, J = 2,1, 8,1 Hz), 8,69 (1H, d, J = 4,6 Hz), 9,03 (1H, s)
247	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,42-1,46 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 3,0 Hz), 1,68-1,79 (2H, m), 1,82 (3H, s), 1,86-2,02 (2H, m), 2,16-2,22 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 1,1, 5,1 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,4, 5,1 Hz), 2,96 (1H, m), 3,74 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,82 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,04 (1H, m), 5,27 (1H, dd, J = 5,1, 11,7 Hz), 6,44 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,6, 7,8 Hz), 7,72 (1H, dd, J = 1,7, 8,3 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 2,2, 8,5 Hz), 8,26 (1H, dd, J = 1,9, 7,8 Hz), 8,58 (1H, dd, J = 1,9, 4,9 Hz), 8,68 (1H, d, J = 3,6 Hz), 9,03 (1H, d, J = 1,7 Hz)
248	0,93 (3H, s), 1,16 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,22 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,42-1,46 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 3,0 Hz), 1,68-1,78 (2H, m), 1,82 (3H, s), 1,86-2,01 (2H, m), 2,17-2,22 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 1,1, 5,1 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,4, 5,1 Hz), 2,62 (3H, s), 2,98 (1H, m), 3,73 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,84 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,8, 11,5 Hz), 5,04 (1H, d, J = 3,4 Hz), 5,25 (1H, dd, J = 5,1, 11,4 Hz), 6,44 (1H, s), 7,22 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,40 (1H, dd, J = 4,9, 8,0 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 2,2, 8,0 Hz), 8,18 (1H, d, J = 7,8 Hz), 8,69 (1H, d, J = 3,7 Hz), 8,99 (1H, d, J = 1,7 Hz)

249	0,91 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,8 Hz), 1,15 (3H, t, J = 7,8 Hz), 1,26 (1H, s), 1,29-1,39 (1H, m), 1,42 (3H, s), 1,45 (1H, m), 1,57-1,64 (2H, m), 1,66 (3H, s), 1,81-1,88 (2H, m), 2,14-2,18 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,8 Hz), 2,35 (2H, q, J = 7,8 Hz), 2,84 (1H, m), 3,46 (3H, s), 3,68 (1H, d, J = 11,7 Hz), 3,93 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,73-4,87 (4H, m), 4,95-5,00 (1H, m), 6,43 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 4,8, 8,0 Hz), 8,12 (1H, m), 8,69 (1H, m), 9,01 (1H, d, J = 2,2 Hz)
250	0,92 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,34-1,55 (3H, m), 1,46 (3H, s), 1,71 (3H, s), 1,66-1,92 (6H, m), 2,01-2,18 (4H, m), 2,38-2,57 (3H, m), 3,66-3,78 (1H, m), 3,95-4,13 (1H, m), 4,73-4,84 (1H, m), 4,89-4,95 (1H, m), 4,99-5,10 (1H, m), 6,45 (1H, s), 7,43 (1H, dd, J = 4,9, 8,3 Hz), 8,11 (1H, m), 8,70 (1H, d, J = 4,9 Hz), 9,02 (1H, s)

[Tabla 26]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
251	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,17 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,36 (9H, s), 1,42 (1H, m), 1,47 (3H, s), 1,62-1,70 (3H, m), 1,75 (3H, s), 1,80-1,95 (2H, m), 2,07-2,21 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,5, 7,5 Hz), 2,40 (2H, dq, J = 3,9, 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,69 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,87 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,04 (1H, m), 5,36 (1H, dd, J = 5,1, 11,7 Hz), 6,53 (1H, s), 7,39-7,43 (1H, m), 7,98 (1H, dd, J = 1,7, 8,0 Hz), 8,02 (1H, s), 8,10 (1H, dt, J = 1,7, 8,0 Hz), 8,65 (1H, dd, J = 1,5, 4,7 Hz), 8,69 (1H, d, J = 3,7 Hz), 8,99 (1H, s)
252	3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,42-1,45 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,62-1,73 (3H, m), 1,82 (3H, s), 1,84-2,00 (2H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,5, 7,5 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,5, 7,5 Hz), 2,96 (1H, m), 3,68 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,85 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,82 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,04 (1H, m), 5,37 (1H, dd, J = 4,8, 11,7 Hz), 6,44 (1H, s), 7,36-7,41 (2H, m), 8,08 (1H, dt, J = 1,7, 8,0 Hz), 8,53 (1H, d, J = 2,0 Hz), 8,68 (1H, dd, J = 0,7, 4,9 Hz), 8,98 (1H, d, J = 2,6 Hz)
253	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,40-1,47 (1H, m), 1,51 (3H, s), 1,64 (1H, d, J = 2,4 Hz), 1,73 (2H, m), 1,87 (3H, s), 1,85-2,00 (2H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 1,5, 7,6 Hz), 2,96 (1H, m), 3,71 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,05 (1H, m), 5,39 (1H, dd, J = 5,2, 11,6 Hz), 6,42 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,02 (1H, s), 8,07 (1H, m), 8,68 (1H, d, J = 4,4 Hz), 8,80-8,83 (1H, m), 8,97 (1H, m), 9,38 (1H, m)
254	0,91 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,46 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,63 (1H, d, J = 2,7 Hz), 1,70-1,73 (2H, m), 1,85 (3H, s), 1,88-2,01 (2H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,5 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,2, 7,6 Hz), 2,97 (1H, m), 3,68 (1H, d, J = 11,7 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,04 (1H, m), 5,34 (1H, dd, J = 5,4, 11,5 Hz), 6,44 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,0 Hz), 8,07 (1H, dt, J = 1,9, 6,3 Hz), 8,32 (1H, d, J = 2,0 Hz), 8,67 (1H, d, J = 4,1 Hz), 8,92 (1H, d, J = 2,0 Hz), 8,98 (1H, s)
255	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,45 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,60 (1H, d, J = 3,0 Hz), 1,68-1,70 (2H, m), 1,83 (3H, s), 1,75-1,98 (2H, m), 2,17-2,21 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 1,7, 7,5 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,2, 7,5 Hz), 2,97 (1H, m), 3,67 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,87 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,81 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,03 (1H, m), 5,23 (1H, dd, J = 5,1, 11,5 Hz), 6,46 (1H, s), 7,07 (1H, d, J = 5,2 Hz), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,54 (1H, d, J = 5,3 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 2,2, 8,1 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,4, 4,9 Hz), 8,99 (1H, d, J = 2,2 Hz)

[Tabla 27]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
256	0,92 (3H, s), 1,12 (3H, t, J = 7,8 Hz), 1,15 (3H, t, J = 7,7 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,47 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 2,4 Hz), 1,69-1,81 (2H, m), 1,85 (3H, s), 1,90-1,99 (2H, m), 2,18-2,21 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 1,2, 7,7 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,7, 7,6 Hz), 2,66 (3H, s), 2,96 (1H, m), 3,72 (1H, d, J = 11,7 Hz), 3,83 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 5,04 (1H, m), 5,25 (1H, dd, J = 5,3, 11,7 Hz), 6,41 (1H, s), 7,30 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 8,07 (1H, dt, J = 2,2, 8,1 Hz), 8,24 (1H, dd, J = 2,2, 8,0 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 8,97 (1H, d, J = 2,2 Hz), 9,18 (1H, d, J = 2,2 Hz)
257	0,91 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,46 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,63 (1H, d, J = 2,4 Hz), 1,70-1,73 (2H, m), 1,86 (3H, s), 1,83-1,98 (2H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,5, 7,7 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,2, 7,7 Hz), 2,96 (1H, d, J = 1,9 Hz), 3,68 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,84 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,05 (1H, m), 5,32 (1H, dd, J = 5,3, 11,7 Hz), 6,43 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 4,9, 8,0 Hz), 7,56 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,85 (1H, t, J = 7,8 Hz), 8,07 (2H, m), 8,67 (1H, dd, J = 1,7, 4,9 Hz), 8,98 (1H, d, J = 2,0 Hz)
258	0,91 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,38-1,46 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,62 (1H, d, J = 2,4 Hz), 1,69-1,72 (2H, m), 1,86 (3H, s), 1,80-1,96 (2H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,5 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 2,2, 7,5 Hz), 2,93 (1H, d, J = 1,9 Hz), 3,68 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,83 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 5,04 (1H, m), 5,33 (1H, dd, J = 5,3, 11,5 Hz), 6,42 (1H, s), 7,20 (1H, dd, J = 2,9, 8,0 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,3 Hz), 8,00 (1H, q, J = 7,8 Hz), 8,08

ES 2 645 373 T3

	(2H, m), 8,67 (1H, dd, J = 1,4, 4,6 Hz), 8,97 (1H, d, J = 2,2 Hz)
259	3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,21 (3H, t J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,40-1,47 (1H, m), 1,51 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 3,0 Hz), 1,70-1,83 (2H, m), 1,86 (3H, s), 1,92-1,98 (2H, m), 2,17-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,3 Hz), 2,43 (2H, dq, J = 1,4, 5,3 Hz), 2,97 (1H, d, J = 2,0 Hz), 3,74 (1H, d, J = 11,7 Hz), 3,83 (1H, d, J = 11,7 Hz), 4,13 (3H, s), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 5,05 (1H, m), 5,24 (1H, dd, J = 5,3, 11,7 Hz), 6,43 (1H, s), 7,16-7,20 (1H, m), 7,35-7,44 (4H, m), 7,70 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,05 (1H, dt, J = 1,7, 8,3 Hz), 8,66 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 8,96 (1H, d, J = 2,2 Hz)
260	0,93 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,19 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,40-1,46 (1H, m), 1,48 (3H, s), 1,63 (1H, d, J = 3,0 Hz), 1,71-1,74 (2H, m), 1,80 (3H, s), 1,83-1,95 (1H, m), 2,02-2,06 (1H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,7, 7,6 Hz), 2,41 (2H, dq, J = 3,4, 7,5 Hz), 2,96 (1H, m), 3,70 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,87 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,8, 11,5 Hz), 5,05 (1H, m), 5,37 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 6,46 (1H, s), 7,39-7,45 (2H, m), 7,87 (1H, dd, J = 1,5, 8,3 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 1,5, 8,3 Hz), 8,64 (1H, dd, J = 1,2, 4,6 Hz), 8,69 (1H, d, J = 4,9 Hz), 8,97 (1H, d, J = 2,2 Hz)
261	0,85-1,06 (8H, m), 0,92 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,30-1,40 (1H, m), 1,42 (3H, s), 1,45-1,63 (5H, m), 1,67 (3H, s), 1,81-1,92 (2H, m), 2,14-2,25 (2H, m), 2,88 (1H, d, J = 1,4 Hz), 3,75 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,86 (1H, d, J = 11,6 Hz), 3,78-3,82 (1H, m), 4,82 (1H, dd, J = 5,1, 11,4 Hz), 5,00 (1H, m), 6,52 (1H, s), 7,42 (1H, dd, J = 4,9, 8,0 Hz), 8,11 (1H, dt, J = 1,7, 8,0 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 9,01 (1H, d, J = 1,9 Hz)

[Tabla 28]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
262	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,47 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,61 (1H, d, J = 2,7 Hz), 1,66-1,71 (2H, m), 1,84 (3H, s), 1,76-1,99 (2H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,0, 7,5 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,7, 7,5 Hz), 2,96 (1H, m), 3,73 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,82 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,04 (1H, m), 5,26 (1H, dd, J = 5,1, 11,7 Hz), 6,44 (1H, s), 7,35-7,41 (2H, m), 8,07 (1H, dt, J = 1,7, 8,0 Hz), 8,44-8,50 (2H, m), 8,67 (1H, d, J = 4,9 Hz), 8,98 (1H, d, J = 1,7 Hz)
263	0,92 (3H, s), 1,12 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,30-1,47 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,62 (1H, d, J = 2,4 Hz), 1,69-1,71 (2H, m), 1,85 (3H, s), 1,75-1,97 (2H, m), 2,18-2,22 (1H, m), 2,33 (2H, dq, J = 0,9, 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,4, 7,6 Hz), 2,98 (1H, m), 3,73 (1H, d, J = 11,6 Hz), 3,81 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,05 (1H, m), 5,26 (1H, dd, J = 5,1, 11,5 Hz), 6,40 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,0 Hz), 7,80 (2H, d, J = 8,8 Hz), 8,06 (1H, dt, J = 1,7, 8,0 Hz), 8,21 (2H, d, J = 8,8 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 8,96 (1H, d, J = 1,7 Hz)
264	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,20 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,47 (1H, m), 1,51 (3H, s), 1,62 (1H, d, J = 2,4 Hz), 1,68-1,82 (2H, m), 1,86 (3H, s), 1,93-2,01 (2H, m), 2,19-2,23 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,0, 7,6 Hz), 2,42 (2H, dq, J = 2,4, 7,5 Hz), 2,97 (1H, m), 3,73 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,80 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,7 Hz), 5,05 (1H, m), 5,26 (1H, dd, J = 5,1, 11,5 Hz), 6,41 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,1, 8,0 Hz), 7,65 (1H, m), 7,90 (1H, dt, J = 1,5, 7,8 Hz), 8,07 (1H, dt, J = 2,2, 8,0 Hz), 8,34 (1H, dt, J = 1,5, 7,8 Hz), 8,38 (1H, t, J = 1,5 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 8,96 (1H, d, J = 2,4 Hz)
265	0,92 (3H, s), 1,14 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,21 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,26 (1H, s), 1,39-1,48 (1H, m), 1,51 (3H, s), 1,63 (1H, d, J = 2,7 Hz), 1,63-1,83 (2H, m), 1,86 (3H, s), 1,90-1,98 (2H, m), 2,18-2,23 (1H, m), 2,33 (2H, q, J = 7,5 Hz), 2,43 (2H, dq, J = 2,5, 7,6 Hz), 2,97 (1H, m), 3,72 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,82 (1H, d, J = 12,0 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 5,05 (1H, d, J = 4,1 Hz), 5,28 (1H, dd, J = 5,1, 11,5 Hz), 6,42 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,9, 8,0 Hz), 7,65 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,88 (1H, d, J = 7,8 Hz), 8,06 (1H, dt, J = 1,8, 8,0 Hz), 8,30 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,36 (1H, s), 8,67 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 8,97 (1H, d, J = 2,2 Hz)
266	0,89 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,14 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,33-1,37 (1H, m), 1,42 (3H, s), 1,46-1,55 (1H, m), 1,58 (3H, s), 1,60-1,70 (2H, m), 1,78-1,91 (2H, m), 2,13-2,17 (1H, m), 2,32 (2H, dq, J = 1,7, 7,3 Hz), 2,35 (2H, q, J = 7,3 Hz), 2,89 (1H, m), 3,66 (1H, d, J = 11,4 Hz), 3,81 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,96 (2H, s), 4,76-4,82 (1H, m), 4,98-5,06 (2H, m), 6,38 (1H, s), 7,17-7,25 (1H, m), 7,36-7,46 (2H, m), 7,69-7,73 (1H, m), 8,08-8,12 (1H, m), 8,60 (1H, dt, J = 1,0, 4,9 Hz), 8,70 (1H, dd, J = 1,7, 4,9 Hz), 9,00 (1H, d, J = 1,4 Hz)

[Tabla 29]

N.º de compuesto	RMN- <sup>1</sup> H δ (ppm)
267	0,89 (3H, s), 1,13 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,15 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,26 (1H, s), 1,43 (3H, s), 1,50 (3H, d, J = 3,0 Hz), 1,61 (3H, s), 1,58-1,70 (2H, m), 1,75-1,93 (2H, m), 2,14-2,18 (1H, m), 2,32 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,36 (2H, q, J = 7,6 Hz), 2,90 (1H, d, J = 1,9 Hz), 3,70 (1H, d, J = 12,0 Hz), 3,74 (2H, s), 3,77 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,79 (1H, dd, J = 4,9, 11,4 Hz), 4,96-5,00 (2H, m), 6,37 (1H, s), 7,32 (1H, dd, J = 4,8, 7,6 Hz), 7,42 (1H, dd, J = 4,9, 8,1 Hz), 7,71 (1H, d, J = 7,8 Hz), 8,12 (1H, dt, J = 1,9, 8,1 Hz), 8,57 (1H, dd, J = 1,6, 4,8 Hz), 8,65 (1H, d, J = 1,9 Hz), 8,70 (1H, dd, J = 1,6, 4,7 Hz), 9,04 (1H, d, J = 4,2 Hz)
269	0,85-1,11 (8H, m), 0,93 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,39-1,47 (1H, m), 1,50 (3H, s), 1,55-1,68 (5H, m), 1,87 (3H, s), 1,83-2,02 (2H, m), 2,17-2,22 (1H, m), 2,96 (1H, s), 3,79 (1H, d, J = 12,2 Hz), 3,83 (1H, d, J =

	12,1 Hz), 4,85 (1H, dd, J = 4,9, 11,5 Hz), 5,04 (1H, m), 5,38 (1H, dd, J = 5,12, 11,6 Hz), 6,46 (1H, s), 7,38 (1H, dd, J = 4,8, 8,2 Hz), 7,69-7,80 (2H, m), 7,87 (1H, m), 8,08 (1H, dt, J = 2,2, 8,0 Hz), 8,22 (1H, dd, J = 1,7, 7,5 Hz), 8,67 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 8,98 (1H, d, J = 2,4 Hz)
270	0,86-1,10 (8H, m), 0,94 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,38-1,46 (1H, m), 1,49 (3H, s), 1,57-1,69 (5H, m), 1,75 (3H, s), 1,78-2,05 (2H, m), 2,18-2,21 (1H, m), 2,93 (1H, m), 3,80 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,84 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,84 (1H, dd, J = 5,0, 11,6 Hz), 5,04 (1H, m), 5,31 (1H, dd, J = 5,0, 11,8 Hz), 6,42 (1H, s), 7,40 (1H, dd, J = 4,9, 8,3 Hz), 7,70 (1H, d, J = 5,3 Hz), 8,09 (1H, dt, J = 1,7, 8,1 Hz), 8,69 (1H, dd, J = 1,6, 4,7 Hz), 8,97 (1H, d, J = 5,1 Hz), 9,00 (1H, d, J = 2,2 Hz), 9,17 (1H, s)
271	0,85-1,08 (8H, m), 0,92 (3H, s), 1,26 (1H, s), 1,38-1,46 (1H, m), 1,48 (3H, s), 1,56-1,68 (5H, m), 1,79 (3H, s), 1,83-2,08 (2H, m), 2,18-2,21 (1H, m), 2,95 (1H, m), 3,76 (1H, d, J = 11,9 Hz), 3,86 (1H, d, J = 11,9 Hz), 4,83 (1H, dd, J = 4,9, 11,5 Hz), 5,04 (1H, m), 5,39 (1H, dd, J = 5,1, 11,9 Hz), 6,46 (1H, s), 7,34-7,45 (2H, m), 7,86 (1H, dd, J = 1,3, 8,0 Hz), 8,08 (1H, dt, J = 2,0, 8,0 Hz), 8,64 (1H, dd, J = 1,2, 4,7 Hz), 8,68 (1H, dd, J = 1,5, 4,9 Hz), 9,00 (1H, d, J = 2,2 Hz)

Ejemplo 11

Ejemplo de preparación 1 [Polvo humectable]

5 Compuesto de acuerdo con la presente invención

(Compuesto n.º 82)	30 % en peso
Arcilla	30 % en peso
Tierra de diatomeas	35 % en peso
Lignin sulfonato cálcico	4 % en peso
Laurilsulfato sódico	1 % en peso

Los ingredientes anteriores se mezclaron juntos homogéneamente y la mezcla se molió para preparar polvo humectable.

10

Ejemplo de preparación 2 [Polvo]

Compuesto de acuerdo con la presente invención

(Compuesto n.º 82)	2 % en peso
Arcilla	60 % en peso
Talco	37 % en peso
Estearato cálcico	1 % en peso

15

Los ingredientes anteriores se mezclaron juntos homogéneamente para preparar polvo.

Ejemplo de preparación 3 [Concentrado emulsionable]

20 Compuesto de acuerdo con la presente invención

(Compuesto n.º 82)	20 % en peso
N,N-dimetilformamida	20 % en peso
Solvesso 150 (Exxon Mobil Corporation)	50 % en peso
Alquilaryl éter de polioxietileno	10 % en peso

Los ingredientes anteriores se mezclaron juntos homogéneamente y se disolvieron para preparar concentrado emulsionable.

25

Ejemplo de preparación 4 [Gránulos]

Compuesto de acuerdo con la presente invención

(Compuesto de referencia n.º 28)	5 % en peso
Bentonita	40 % en peso
Talco	10 % en peso
Arcilla	43 % en peso

Lignin sulfonato cálcico 2 % en peso

Los ingredientes anteriores se molieron homogéneamente y se mezclaron juntos homogéneamente. Se añadió agua a la mezcla, seguido de amasado exhaustivo. En lo sucesivo, el producto amasado se granuló y se secó para preparar gránulos.

5

#### Ejemplo de preparación 5 [Fluidos]

Compuesto de acuerdo con la presente invención

(Compuesto de referencia n.º 28)	25 % en peso
POE piliestirilfenil éter sulfato	5 % en peso
Propilenglicol	6 % en peso
Bentonita	1 % en peso
Solución acuosa de goma xantana al 1 %	3 % en peso
PRONAL EX300 (Toho Chemical Industry Co., Ltd.)	0,05 % en peso
ADDAC 827 (K.I. Chemical Industry Co., Ltd.)	0,02 % en peso
Agua	Hasta el 100 % en peso

10

Los ingredientes anteriores excepto la solución acuosa de goma xantana al 1 % y una cantidad adecuada de agua se premezclaron juntos y la mezcla se molió después mediante un molino de molienda en húmedo. En lo sucesivo, la solución acuosa de goma xantana al 1 % y el agua restante se añadieron al producto molido para preparar fluidos al 100 % en peso.

15

#### Ejemplo de ensayo 1: Efecto plaguicida contra *Myzus persicae*

Entre los compuestos de fórmula (I) producidos con el método convencional descrito anteriormente, los compuestos mostrados en las Tablas 1 a 14 y el piripiropeno A se ensayaron para el efecto plaguicida.

20

Se cortó de un repollo desarrollado en un tiesto un disco de hoja con un diámetro de 2,8 cmφ y se dispuso en un cuenco Schale de 5,0 cm. Se liberaron cuatro áfidos adultos de *Myzus persicae* en el cuenco Schale. Un día después de la liberación de los áfidos adultos se extrajeron los áfidos adultos. El número de larvas en el primer estadio nacidas en el disco de hoja se ajustó a 10, y la solución de ensayo, que se había ajustado a una concentración de 20 ppm con la adición de una solución de acetona acuosa al 50 % (se añadió 0,05 % de Tween 20) se roció sobre el disco de hoja de repollo. Luego se secó al aire el disco de hoja de repollo. A continuación se tapó el cuenco Schale y se dejó reposar en un recinto de temperatura controlada (periodo de luz 16 horas - periodo de oscuridad 8 horas) (25 °C). Tres días después de la iniciación del reposo del cuenco Schale se observaron las larvas respecto de supervivencia o muerte, y se calculó la tasa de mortalidad de larvas mediante la ecuación siguiente

30

$$\text{Tasa de mortalidad (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas supervivientes} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100.$$

35

Como resultado se encontró que la tasa de mortalidad no fue inferior al 80 % para los compuestos de n.º 1, 6, 8, 9, 10, 12, 14, 16, 18, 20, 23, 25, 28, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 44, 45, 49, 54, 56, 57, 61, 69, 76, 82, 85, 86, 88, 90, 91, 98, 103, 106, 107, 108, 109, 111, 125, 128, 133, 135, 137, 139, 142, 153, 160, 161, 162, 164, 167, 169, 170, 171, 172, 176, 180, 182, 183, 186, 187, 190, 196, 201, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 236, 237, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 273 y 274 y piripiropeno A.

40

#### Ejemplo de ensayo 2: Efecto plaguicida contra *Myzus persicae*

45

Entre los compuestos de fórmula (I) producidos con el método convencional descrito anteriormente, los compuestos mostrados en las Tablas 1 a 14 y el piripiropeno A se ensayaron para el efecto plaguicida.

Se cortó de un repollo desarrollado en un tiesto un disco de hoja con un diámetro de 2,8 cmφ y se dispuso en un cuenco Schale de 5,0 cm. Se liberaron cuatro áfidos adultos de *Myzus persicae* en el cuenco Schale. Un día después de la liberación de los áfidos adultos se extrajeron los áfidos adultos. El número de larvas en el primer estadio nacidas en el disco de hoja se ajustó a 10, y la solución de prueba, que se había ajustado a una concentración de 0,156 ppm con la adición de una solución de acetona acuosa al 50 % (se añadió 0,05 % de Tween 20) se roció sobre el disco de hoja de repollo. Luego se secó al aire el disco de hoja de repollo. A continuación se

50



tapó el cuenco Schale y se dejó reposar en un recinto de temperatura controlada (periodo de luz 16 horas - periodo de oscuridad 8 horas) (25 °C). Tres días después de la iniciación del reposo del cuenco Schale se observaron las larvas respecto de supervivencia o muerte, y se calculó la tasa de mortalidad de larvas de igual modo que en el Ejemplo de ensayo 1.

- 5 Como resultado se encontró que la tasa de mortalidad no fue inferior al 80 % para los compuestos n.º 12, 23, 28, 45, 54, 56, 76, 82, 85, 86, 90, 164, 201, 205, 206, 207, 212, 213, 217, 218, 219, 222, 227, 228, 229, 231, 232, 233, 237, 239, 240, 242, 246, 247, 249, 250, 252, 253, 256, 258, 261, 262, 264, 265, 266, 267, 269, 270 y 271.

10 Ejemplo de ensayo 3: Efecto plaguicida contra *Plutella xylostella*

Un disco de hoja de repollo con un diámetro de 5 cm se dispuso en una copa de plástico. Los compuestos de ensayo, que se habían diluido hasta una concentración predeterminada con la adición de una solución de acetona acuosa al 50 % (se añadió Tween 20, al 0,05 %), se rociaron sobre el disco de hoja de repollo por medio de una pistola pulverizadora y luego se secó al aire el disco de hoja de repollo. Se liberaron en la copa cinco larvas en el segundo estadio de *Plutella xylostella*. Luego se tapó la copa y las larvas se criaron en el recinto de temperatura controlada (25 °C). Tres días después del tratamiento se observaron las larvas respecto de supervivencia o muerte y se calculó la tasa de mortalidad de las larvas de igual modo que en el Ejemplo de ensayo 1.

15 Como resultado se encontró que la tasa de mortalidad no fue inferior al 80 % para los compuestos n.º 76, 213, 218, 237 y 250 a una concentración de 500 ppm.

20 Ejemplo de ensayo 4: Efecto plaguicida contra *Helicoverpa armigera*

Un disco de hoja de repollo con un diámetro de 2,8 cm se dispuso en una copa de plástico. Los compuestos de ensayo, que se habían diluido hasta una concentración predeterminada con la adición de una solución de acetona acuosa al 50 % (se añadió Tween 20, al 0,05 %), se rociaron sobre el disco de hoja de repollo por medio de una pistola pulverizadora y luego se secó al aire el disco de hoja de repollo. Se liberó en la copa una larva en el tercer estadio de *Helicoverpa armigera*. Luego se tapó la copa y la larva se crió en el recinto de temperatura controlada (25 °C). Tres días después del tratamiento se observó la larva respecto de supervivencia o muerte. El ensayo se repitió 5 veces. Además, se calculó la tasa de mortalidad de las larvas de igual modo que en el Ejemplo de ensayo 1.

30 Como resultado se encontró que la tasa de mortalidad no fue inferior al 80 % para el compuesto n.º 219 a una concentración de 100 ppm.

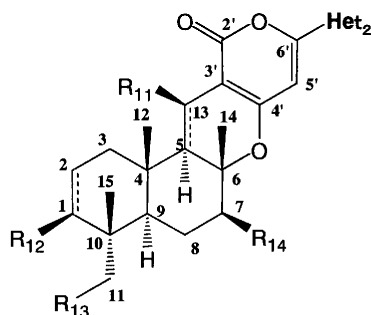
Ejemplo de ensayo 5: Efecto plaguicida contra *Trigonotylus caelestialium*

35 Se sumergió un semillero de trigo durante 30 segundos en una solución en la que se había diluido cada compuesto de prueba hasta una concentración predeterminada mediante la adición de una solución de acetona acuosa al 50 % (se añadió Tween 20, al 0,05 %). El semillero de trigo se secó al aire y luego se dispuso en un cilindro de vidrio. Luego se liberaron en el cilindro de vidrio dos larvas en el segundo estadio de *Trigonotylus caelestialium*. Durante la prueba el semillero de trigo recibió un suministro de agua desde el fondo del cilindro de vidrio. Tres días después del tratamiento se observó la supervivencia o muerte de las larvas y se calculó la tasa de mortalidad de las larvas de igual modo que en el Ejemplo de ensayo 1.

40 Como resultado se encontró que la tasa de mortalidad no fue inferior al 80 % para los compuestos n.º 218 y 261 a una concentración de 100 ppm.

## REIVINDICACIONES

1. Uso no terapéutico de un compuesto representado por la fórmula (Ia), o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como un agente de control de plagas de hemípteros:



(I a)

en la que

Het<sub>2</sub> representa 3-piridilo,

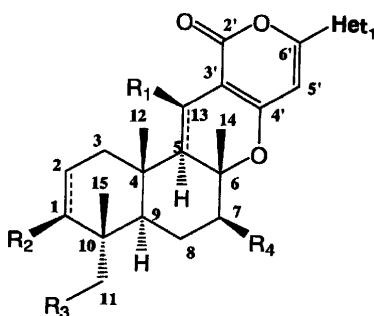
R<sub>11</sub> representa hidroxilo,

R<sub>12</sub>, R<sub>13</sub> y R<sub>14</sub> representan acetiloxi.

2. El uso de acuerdo con la reivindicación 1, en el que dicha plaga de hemípteros se selecciona de *Aphidoidea*, *Coccoidea* o *Aleyrodidae*.

3. El uso de acuerdo con la reivindicación 1, en el que dicha plaga de hemípteros es al menos una plaga seleccionada del grupo que consiste en *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Aphis fabae*, *Aphis maidis* (áfido de la hoja del maíz), *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Aphis craccivora*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum avenae*, *Metopolophium dirhodum*, *Rhopalosiphum padi*, *Schizaphis graminum*, *Brevicoryne brassicae*, *Lipaphis erysimi*, *Aphis citricola*, áfido rosa de la manzana, *Eriosoma lanigerum*, *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus* y *Pseudococcus comstocki*.

4. Un compuesto representado por la fórmula (Ib) o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo:



(I b)

en la que

Het<sub>1</sub> representa 3-piridilo,

R<sub>1</sub> representa hidroxilo,

R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan propioniloxi o

alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>3-6</sub> cíclico o piridilo y

R<sub>4</sub> representa hidroxilo,

alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>3-6</sub> cíclico o piridilo,

benzoiloxi opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido con un átomo halógeno, ciano o nitro, o

carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alquiloxi C<sub>1-4</sub> o trifluorometilo,

en la que el carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado se selecciona del grupo que consiste en tienilo, furilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, oxazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, tetrahidropiranilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo y manosilo y

- en el que el alquilo es de cadena recta, de cadena ramificada, de cadena cíclica o una combinación de los mismos,  
 con la condición de que se excluya
- 5 un compuesto en el que  
 Het<sub>1</sub> represente 3-piridilo,  
 R<sub>1</sub> represente hidroxilo,  
 R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representen propioniloxi y  
 R<sub>4</sub> represente hidroxilo y
- 10 un compuesto en el que  
 Het<sub>1</sub> represente 3-piridilo,  
 R<sub>1</sub> represente hidroxilo,  
 R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representen ciclopropilcarboniloxi y  
 R<sub>4</sub> represente hidroxilo, ciclopropilcarboniloxi o 2-cianobenzoiloxi.
- 15 5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo, en el que  
 R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>3-6</sub> cíclico o piridilo y  
 R<sub>4</sub> representa hidroxilo, alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>3-6</sub>
- 20 cíclico o piridilo o  
 benzoiloxi opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido con un átomo halógeno, ciano o nitro.
- 25 6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo, en el que  
 R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> representan propioniloxi y  
 R<sub>4</sub> representa alquilcarboniloxi C<sub>3-6</sub> cíclico opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>3-6</sub> cíclico o piridilo o
- 30 carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado opcionalmente sustituido con un átomo halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alquiloxi C<sub>1-4</sub> o trifluorometilo,  
 en el que el carboniloxi heterocíclico de cinco o seis miembros saturado o insaturado se selecciona del grupo que consiste en tienilo, furilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, oxazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, tetrahidropiranilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo y manosilo
- 35 7. Una composición para su uso como un agente para el control de plagas que comprende el compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como ingrediente activo y un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable.
- 40 8. Un método para controlar una plaga de hemípteros, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ia) de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo a una planta o terreno.
- 45 9. Un método para controlar una plaga, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto representado por la fórmula (Ib) de acuerdo con la reivindicación 4, o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo a una planta o terreno.
10. Uso no terapéutico de un compuesto representado por la fórmula (Ib) de acuerdo con la reivindicación 4, o una sal agrícola y hortícolamente aceptable del mismo como un agente de control de plagas.