

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 651 491**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 13/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **30.05.2014 PCT/JP2014/064492**

87 Fecha y número de publicación internacional: **04.12.2014 WO14192936**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.05.2014 E 14805163 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **27.09.2017 EP 3006444**

54 Título: **Compuesto de amida heterocíclico**

30 Prioridad:

31.05.2013 JP 2013115196

18.10.2013 JP 2013217697

29.01.2014 JP 2014013999

31.03.2014 JP 2014072736

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
26.01.2018

73 Titular/es:

**NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD. (100.0%)
7-1 Kanda-Nishiki-cho 3-chome Chiyoda-ku
Tokyo 101-0054, JP**

72 Inventor/es:

**NAKAYA, YOSHIHIKO;
TANIMA, DAISUKE;
INABA, MASAMITSU;
MIYAKADO, YUUKI;
FURUHASHI, TAKAMASA y
MAEDA, KAZUSHIGE**

74 Agente/Representante:

FÚSTER OLAGUIBEL, Gustavo Nicolás

ES 2 651 491 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto de amida heterocíclico

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un compuesto de amida heterocíclico novedoso y a una sal del mismo, y a productos químicos agrícolas, en particular herbicidas, que contienen el compuesto de amida heterocíclico y la sal del mismo como componente activo. El producto químico agrícola en la presente invención significa un insecticida/acaricida, un nematocida, un herbicida, un bactericida y similares en los campos agrícola y hortícola.

Técnica anterior

Por ejemplo, un determinado tipo de compuestos de amida heterocíclicos se ha divulgado en los documentos de patente 1 a 6. Sin embargo, el compuesto de amida heterocíclico según la presente invención no se ha divulgado en absoluto.

Documentos de la técnica anterior

20 Documentos de patente

Documento de patente 1: Publicación internacional n.º 2012/028579 (documento WO 2012/028579)

25 Documento de patente 2: Publicación internacional n.º 2012/123409 (documento WO 2012/123409)

Documento de patente 3: Publicación internacional n.º 2012/123416 (documento WO 2012/123416)

Documento de patente 4: Publicación internacional n.º 2012/126932 (documento WO 2012/126932)

30 Documento de patente 5: Publicación internacional n.º 2013/017559 (documento WO 2013/017559)

Documento de patente 6: Publicación internacional n.º 2013/064457 (documento WO 2013/064457)

Sumario de la invención

35 Problema que va a solucionarse mediante la invención

Un objeto de la presente invención es proporcionar una sustancia química que ejerce efectos de manera fiable sobre diversas malas hierbas en una baja cantidad de aplicación de la sustancia química, tiene una contaminación de la tierra reducida e influencia sobre cultivos satisfactorios y tiene un alto nivel de seguridad, y es útil como componente activo de herbicidas.

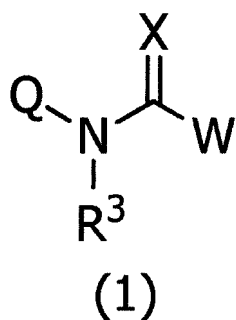
Medios para solucionar el problema

45 Como resultado de una investigación intensiva para solucionar el problema, los inventores de la presente invención han encontrado que un compuesto de amida heterocíclico novedoso de fórmula (1) según la presente invención tiene una excelente actividad herbicida como herbicida y un alto nivel de seguridad para cultivos objetivo así como casi ningún efecto adverso sobre criaturas no objetivo tales como mamíferos, peces e insectos beneficiosos, y que el compuesto es un compuesto extremadamente útil, y por tanto los inventores han realizado la presente invención.

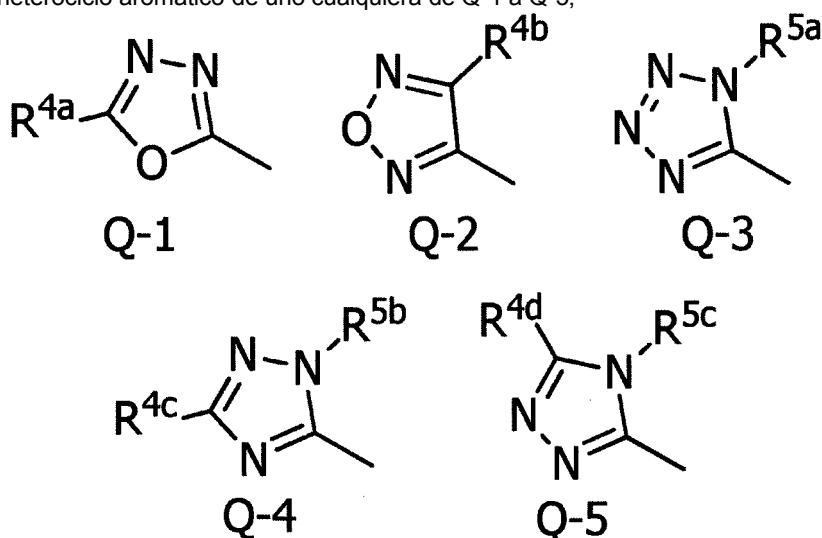
50 Más específicamente, la presente invención se refiere a los siguientes puntos [1] a [115].

[1]

55 Un compuesto de amida heterocíclico de fórmula (1):

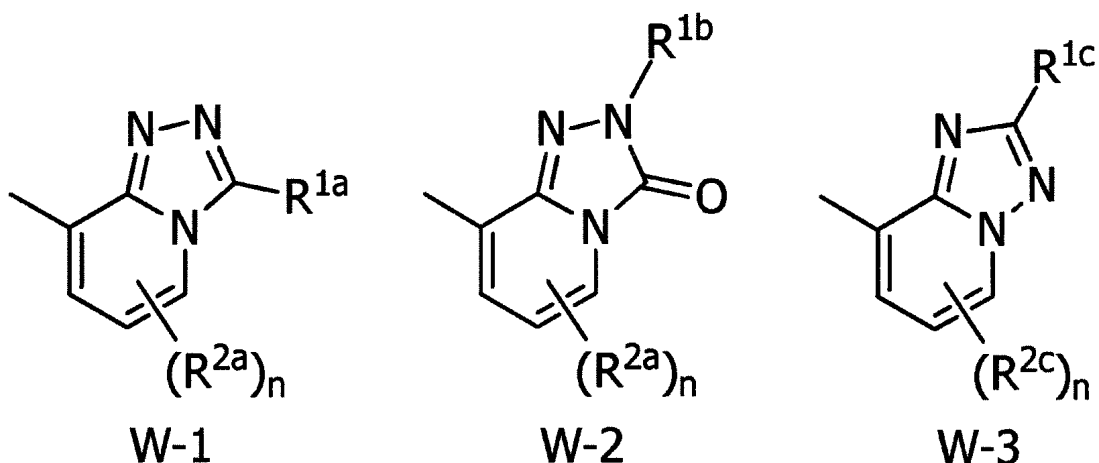


[en donde Q es un heterociclo aromático de uno cualquiera de Q-1 a Q-5;



5

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;



10

X es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

15 R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , alqueno C_{2-6} , alqueno C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , $-C(O)R^9$, $-C(O)OR^{16}$, ciano, $-OR^9$, $-S(O)_mR^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, $-C(=NR^{12b})R^{3b}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, o un grupo cualquiera de U-1 a U-25;

20 R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , alqueno C_{2-6} , alqueno C_{2-6} , fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{1c} es alquilo C_{1-6} ;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{24}$, ciano, nitro, $-OR^{19}$, $-S(O)_mR^{20}$, $-N(R^{21})R^{22}$, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{2a} son adyacentes, los dos R^{2a} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono unidos a cada R^{2a} formando $-CH=CH-CH=CH-$;

R^{2c} es haloalquilo C_{1-6} ;

R^3 es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquino C_{2-6} , $-C(O)R^{25}$ o $-C(O)OR^{26}$;

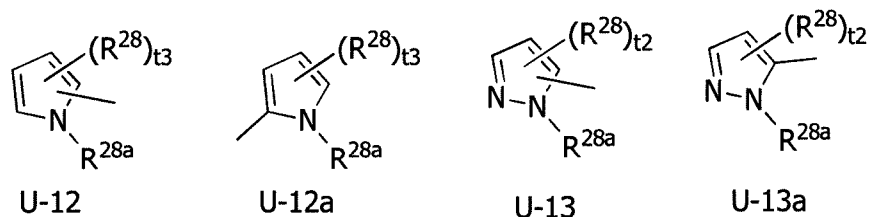
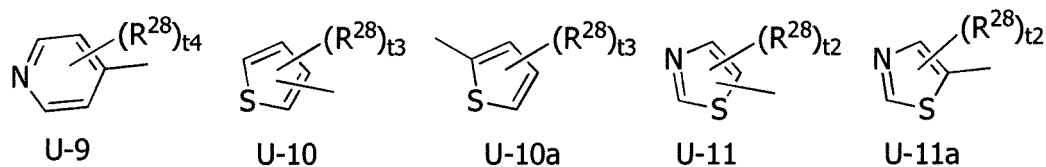
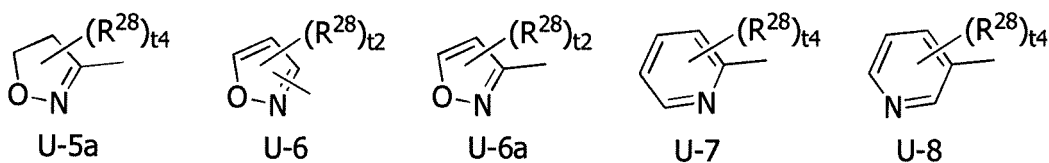
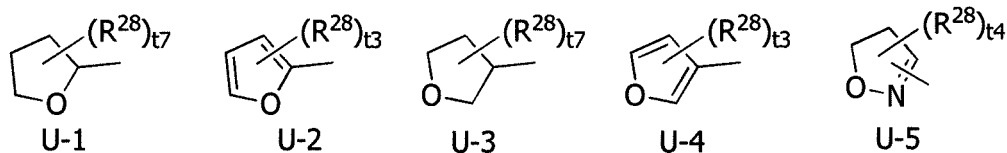
R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquino C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , $-NH_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, $-NHC(O)R^8$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

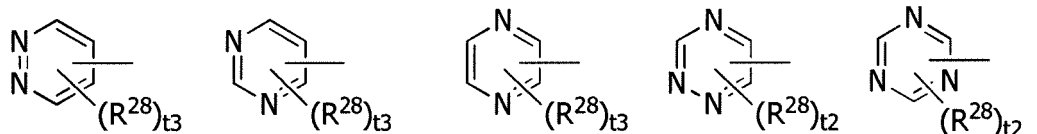
R^{4b} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquino C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{38}$, $-S(O)_mR^{20}$, $-NH_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, $-NHC(O)R^8$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{4d} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{35} ;

U-1 a U-6, U-6a, U-7 a U-10, U-10a, U-11, U-11a, U-12, U-12a, U-13, U-13a, U-14 a U-22, U-22a, U-23, U-24, U-25, y U-26 son heterociclos respectivos de las siguientes estructuras;





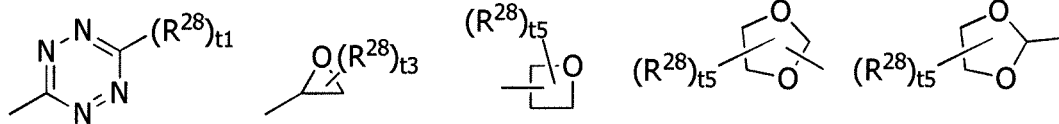
U-14

U-15

U-16

U-17

U-18



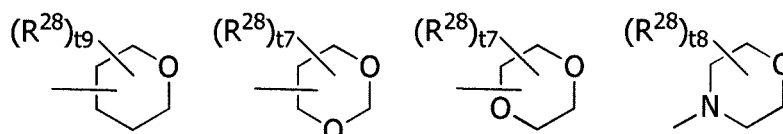
U-19

U-20

U-21

U-22

U-22a



U-23

U-24

U-25

U-26

5

R^{5a} y R^{5b} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , fenilo o fenilo sustituido con $(R^{28})_i$;

10

R^{5c} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{36} , o R^{5c} forma opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} está unido formando $-(CH_2)_4-$ o $-CH=CH-CH=CH-$ con R^{4d} ;

15 R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{13}$, $-S(O)_mR^{14}$, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

20 R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , alquilcarbonilo C_{1-6} , cicloalquilcarbonilo C_{3-6} , haloalquilcarbonilo C_{1-6} , halocicloalquilcarbonilo C_{3-6} , alcoxycarbonilo C_{1-6} , haloalcoxycarbonilo C_{1-6} , alquilaminocarbonilo C_{1-6} , haloalquilaminocarbonilo C_{1-6} , di(alquilo C_{1-6} amino)carbonilo, $-OR^{15}$, $-S(O)_mR^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})aminosulfonilo, $-NH_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclo de 3-7 miembros o heterociclo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

25

R^8 es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o $-N(R^{11a})R^{12a}$;

R^{8b} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

30 R^9 es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o fenilo;

R^{10} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6} ;

35 R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-7, U-8, U-9, o U-14 a U-19, o R^{11} forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquilenos C_{2-6} junto con R^{12} , y en este caso, la cadena de alquilenos contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo;

40

45 R^{11a} y R^{12a} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o fenilo, o R^{11a} forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquilenos C_{2-6} junto con R^{12a} , y en este caso, la cadena de alquilenos contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{12b} es $-OR^{19b}$;

ES 2 651 491 T3

- R¹³ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, -C(O)R⁸ o fenilo;
- 5 R¹⁴ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆ o fenilo;
- R¹⁵ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆ o cicloalquenilo C₃₋₆;
- 10 R¹⁶ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁷;
- R¹⁸ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;
- R¹⁹ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo;
- 15 R^{19b} es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;
- R²⁰ es alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆ o cicloalquenilo C₃₋₆;
- 20 R²¹ y R²² son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo, o R²¹ forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R²¹ y R²² están unidos formando una cadena de alquileo C₂₋₆ junto con R²², y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R³⁹) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo;
- 25 R²⁴ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;
- R²⁵ y R²⁶ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆ o fenilo;
- 30 R²⁷ es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con (R²⁸)_r, -C(O)OR¹⁶, -OR²⁹, -S(O)_mR³⁰, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R²⁸ y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R²⁸ y R^{28a});
- 35 R²⁸ es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, (alcoxi C₁₋₆)-alquilo C₁₋₆, -OR³¹ o -S(O)_mR³⁰; cuando t₂, t₃, t₄, t₅, t₇, t₈ o t₉ es un número entero de 2 o más, R²⁸ son opcionalmente iguales o diferentes entre sí; además cuando dos R²⁸ son adyacentes, los dos R²⁸ adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R²⁸ está unido formando -CH=CH-CH=CH-;
- 40 R^{28a} es alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, (alcoxi C₁₋₆)-alquilo C₁₋₆ o (alquiltio C₁₋₆)-alquilo C₁₋₆;
- R²⁹, R³⁰ y R³¹ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆ o fenilo;
- 45 R³³ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;
- R³⁴ es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -C(O)R⁸, -C(O)OR¹⁶, -OR³³, -S(O)_mR³³, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-1, U-3, U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-25;
- 50 R³⁵ es un átomo de halógeno o alcoxilo C₁₋₆;
- R³⁶ es un átomo de halógeno o alcoxilo C₁₋₆;
- 55 R³⁷ es alcoxilo C₁₋₆;
- R³⁸ es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆ o fenilo;
- 60 R³⁹ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;
- t₁ es un número entero de 0 ó 1;
- m₁, m₂, m₃, m₄, m₆ y t₂ son cada uno independientemente un número entero de 0, 1 ó 2;
- 65 n y t₃ son cada uno independientemente un número entero de 0, 1, 2 ó 3;

p y r son cada uno independientemente un número entero de 1, 2, 3, 4 ó 5;

t4 es un número entero de 0, 1, 2, 3 ó 4;

t5 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

t7 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6 ó 7;

t8 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; y

t9 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 ó 9] o una sal del mismo.

[2]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [1], en el que W es un heterociclo aromático de W-1 o W-2; y

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, -C(O)R¹⁸, -C(O)OR²⁴, ciano, nitro, -OR¹⁹ o -S(O)_{m3}R²⁰, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí.

[3]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [2], en el que R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, naftilo o un grupo cualquiera de U-1 a U-25;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, cicloalquinilo C₃₋₆, -NH₂, alquilamino C₁₋₆, di(alquil C₁₋₆)amino, -NHC(O)R⁸, fenilo, fenilo sustituido con (R²⁸)_r o un grupo cualquiera de U-1 a U-26;

R⁷ es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, cicloalquinilo C₃₋₆, alquilcarbonilo C₁₋₆, cicloalquilcarbonilo C₃₋₆, haloalquilcarbonilo C₁₋₆, halocicloalquilcarbonilo C₃₋₆, alcoxicarbonilo C₁₋₆, haloalcoxicarbonilo C₁₋₆, alquilaminocarbonilo C₁₋₆, haloalquilaminocarbonilo C₁₋₆, di(alquilo C₁₋₆ amino)carbonilo, -OR¹⁵, -S(O)_{m3}R²⁰, alquilaminosulfonilo C₁₋₆, di(alquil C₁₋₆)aminosulfonilo, -NH₂, alquilamino C₁₋₆, di(alquil C₁₋₆)amino o un grupo cualquiera de U-1 a U-26; y

R²⁷ es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con (R²⁸)_r, -C(O)OR¹⁶, -OR²⁹, -S(O)_{m4}R³⁰ o un grupo cualquiera de U-1 a U-26.

[4]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [3], en el que R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquinilo C₃₋₆, -C(O)R⁸, -OR⁹, -S(O)_{m1}R¹⁰, -N(R¹¹)R¹², -C(=NR^{12b})R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{1b} es alquilo C₁₋₆ o alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆ o -S(O)_{m3}R²⁰, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R³ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷, cicloalquilo C₃₋₆, fenilo, fenilo sustituido con (R²⁸)_r o un heterociclo de U-1, U-2, U-7, U-10a o U-26;

R^{4b} es alquilo C₁₋₆;

R^{4c} es un átomo de hidrógeno;

R^{4d} es alquilo C₁₋₆;

ES 2 651 491 T3

- R^{5a} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alquenilo C_{2-6} o fenilo;
- R^{5b} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;
- 5 R^{5c} es alquilo C_{1-6} , o R^{5c} forma opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} está unido formando $-(CH_2)_4-$ o $-CH=CH-CH=CH-$ con R^{4d} ;
- R^7 es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} u $-OR^{15}$;
- 10 R^{8b} es un átomo de hidrógeno;
- R^9 es alquilo C_{1-6} ;
- 15 R^{10} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6} ;
- R^{11} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$ o U-7;
- 20 R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;
- R^{11} forma opcionalmente un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileo C_{4-5} junto con R^{12} , y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O) o S(O)₂;
- 25 R^{11a} es alquilo C_{1-6} ;
- R^{12a} es un átomo de hidrógeno;
- 30 R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , $-C(O)R^8$ o fenilo;
- R^{14} es alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;
- R^{15} es alquilo C_{1-6} ;
- 35 R^{19b} es alquilo C_{1-6} ;
- R^{20} es alquilo C_{1-6} ;
- 40 R^{27} es un átomo de halógeno, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, $-OR^{29}$, $-C(O)OR^{16}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$;
- R^{28} es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} u $-OR^{31}$; cuando t2, t3, t4, t5 o t7 es un número entero de 2 o más, R^{28} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí; y además cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando $-CH=CH-CH=CH-$;
- 45 R^{29} es alquilo C_{1-6} ;
- R^{30} es alquilo C_{1-6} ;
- 50 R^{31} es alquilo C_{1-6} ;
- R^{33} es alquilo C_{1-6} ; y
- 55 R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{33}$, $-S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1, U-8 o U-22a.
- [5]
- 60 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [4], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y
- W es un heterociclo aromático de W-1.
- [6]
- 65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [5], en el que X es un átomo de oxígeno;

R^{1a} un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, -C(O)R⁸, -OR⁹, -S(O)_{m1}R¹⁰, -N(R¹¹)R¹², -C(=NR^{12b})R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

5 R^{2a} es alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆ o -S(O)_{m3}R²⁰, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

10 R⁶ es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -C(O)R⁸, -C(O)OR¹⁶, -OR¹³, -S(O)_{m2}R¹⁴ o fenilo sustituido con (R⁷)_p; y

R²⁷ es un átomo de halógeno, fenilo, -OR²⁹ o -S(O)_{m4}R³⁰.

[7]

15 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [6], en el que R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷ o cicloalquilo C₃₋₆; y

R²⁷ es un átomo de halógeno u -OR²⁹.

20 [8]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [4], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

25 W es un heterociclo aromático de W-1.

[9]

30 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [8], en el que R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, alqueno C₂₋₆, -C(O)R⁸, -S(O)_{m1}R¹⁰, -N(R¹¹)R¹², fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-3, U-5a, U-6a, U-8, U-10a o U-13a;

35 R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R⁶ es un átomo de halógeno, -C(O)OR¹⁶, -OR¹³, -S(O)_{m2}R¹⁴ o fenilo sustituido con (R⁷)_p;

40 R⁷ es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆ u -OR¹⁵;

R⁸ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

45 R¹¹ es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, alqueno C₂₋₆, fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p;

R¹¹ forma opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R¹¹ y R¹² están unidos formando una cadena de alqueno C₅ junto con R¹², y en este caso, la cadena de alqueno contiene opcionalmente un O, S, S(O) o S(O)₂;

50 R¹⁶ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R²⁷ es fenilo sustituido con (R²⁸)_r, -OR²⁹, -C(O)OR¹⁶ o -S(O)_{m4}R³⁰;

55 R²⁸ es un átomo de halógeno o alquilo C₁₋₆; y

R³⁴ es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -OR³³, -S(O)_{m6}R³³, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-1 o U-8.

[10]

60 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según [9], en el que R^{5a} es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷ o alqueno C₂₋₆; y

R²⁷ es -OR²⁹ o -S(O)_{m4}R³⁰.

65 [11]

ES 2 651 491 T3

- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [10], en el que X es un átomo de oxígeno.
- 5 [12]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [10], en el que X es un átomo de azufre.
- 10 [13]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [12], en el que R³ es un átomo de hidrógeno.
- 15 [14]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [12], en el que R³ es alquilo C₁₋₆.
- 20 [15]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [14], en el que R^{2a} es haloalquilo C₁₋₆.
- 25 [16]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [14], en el que R^{2a} es un átomo de halógeno.
- 30 [17]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [14], en el que R^{2a} es -S(O)_mR²⁰; y
R²⁰ es alquilo C₁₋₆.
- 35 [18]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [14], en el que R^{2a} es trifluorometilo.
- 40 [19]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [18], en el que n es un número entero de 1, 2 ó 3.
- 45 [20]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [18], en el que n es un número entero de 1.
- 50 [21]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y
W es un heterociclo aromático de W-1.
- 55 [22]
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y
W es un heterociclo aromático de W-1.
- 60 [23]
- 65

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

5 W es un heterociclo aromático de W-1.

[24]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

10

W es un heterociclo aromático de W-2.

[25]

15 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

20

[26]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

25

W es un heterociclo aromático de W-2.

[27]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

30

W es un heterociclo aromático de W-2.

[28]

35

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

40

[29]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

45

W es un heterociclo aromático de W-3.

[30]

50 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

55

[31]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

60

W es un heterociclo aromático de W-3.

[32]

65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[33]

- 5 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [20], en el que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

10 [34]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es un átomo de hidrógeno.

15 [35]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆.

20 [36]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es alquilo C₁₋₆.

25 [37]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es alquilo C₁₋₃.

30 [38]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es metilo.

[39]

- 35 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es etilo.

[40]

- 40 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es cicloalquilo C₃₋₆.

[41]

- 45 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [33], en el que R^{4a} es haloalquilo C₁₋₃.

[42]

- 50 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es un átomo de hidrógeno.

[43]

- 55 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es alquilo C₁₋₆.

[44]

- 60 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es alquilo C₁₋₃.

[45]

- 65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es metilo.

[46]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es etilo.

5 [47]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷;

10 R²⁷ es -OR²⁹ o -S(O)_mR³⁰;R²⁹ es alquilo C₁₋₆; yR³⁰ es alquilo C₁₋₆.

15

[48]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [41], en el que R^{5a} es alqueno C₂₋₆.

20

[49]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, -CHO, -S(O)_mR¹⁰, -N(R¹¹)R¹², fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

25

R⁶ es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -C(O)OR¹⁶, -OR¹³, -S(O)_mR¹⁴, fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p;

30

R⁸ es alquilo C₁₋₆;R¹⁰ es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆ o alqueno C₂₋₆;

35 R¹¹ es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p o U-7;

R¹² es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

40 R¹¹ forma opcionalmente un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R¹¹ y R¹² están unidos formando una cadena de alqueno C₄₋₅ junto con R¹², y en este caso, la cadena de alqueno contiene opcionalmente un O, S, S(O) o S(O)₂;

R¹³ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴;

45

R¹⁴ es alquilo C₁₋₆ o alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴;R¹⁶ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁷; y

50 R³⁴ es ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -C(O)R⁸, -C(O)OR¹⁶, -OR³³, -S(O)_mR³³ o U-1.

[50]

55 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆ o -CHO.

[51]

60 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo C₁₋₆ o cicloalquilo C₃₋₆.

[52]

65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo C₁₋₆.

[53]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es cicloalquilo C_{3-6} .

5

[54]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ; y

10

R^6 es un átomo de halógeno.

[55]

15 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ; y

R^6 es ciano.

20

[56]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ; y

25

R^6 es cicloalquilo C_{3-6} .

[57]

30 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ; y

30

R^6 es $-C(O)OR^{16}$.

[58]

35 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

35

R^6 es $-OR^{13}$; y

40

R^{13} es alquilo C_{1-6} .

[59]

45 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

45

R^6 es $-OR^{13}$;

50

R^{13} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{34} es $-OR^{33}$; y

55

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

[60]

60 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

60

R^6 es $-S(O)_m R^{14}$;

R^{14} es alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

65

R^{34} es un átomo de halógeno u $-OR^{33}$; y

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

[61]

5 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

R^6 es $-S(O)_m R^{14}$;

10 R^8 es alquilo C_{1-6} ;

R^{14} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{16} es alquilo C_{1-6} ;

15 R^{34} es ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{33}$ o $-S(O)_m R^{33}$; y

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

20 [62]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

25 R^6 es $-S(O)_m R^{14}$; y

R^{14} es alquenoilo C_{2-6} , haloalquenoilo C_{2-6} , alquenoilo C_{2-6} o haloalquenoilo C_{2-6} .

[63]

30 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ; y

R^6 es un átomo de halógeno.

35

[64]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

40

R^6 es $-OR^{13}$; y

R^{13} es alquilo C_{1-6} .

45 [65]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_m R^{10}$.

50 [66]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_m R^{10}$;

55 R^{10} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} o alquenoilo C_{2-6} ;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$ u $-OR^{33}$;

R^8 es alquilo C_{1-6} ;

60

R^{16} es alquilo C_{1-6} ; y

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

65 [67]

- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰; y
- 5 R¹⁰ es alquilo C₁₋₆.
[68]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰; y
- 10 R¹⁰ es cicloalquilo C₃₋₆.
[69]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰; y
- 15 R¹⁰ es alquenilo C₂₋₆.
[70]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰; y
- 25 R¹⁰ es alquinilo C₂₋₆.
[71]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰;
- 30 R¹⁰ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y
R³⁴ es un átomo de halógeno.
[72]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰;
- 40 R¹⁰ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y
R³⁴ es ciano.
[73]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰;
- 50 R¹⁰ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y
R³⁴ es cicloalquilo C₃₋₆.
[74]
- El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_{m1}R¹⁰;
- 60 R¹⁰ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴;
R³⁴ es -C(O)R⁸ y -C(O)OR¹⁶;
R⁸ es alquilo C₁₋₆; y
R¹⁶ es alquilo C₁₋₆.
- 65

[75]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

5

R^{10} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{34} es $-OR^{33}$; y

10 R^{33} es alquilo C_{1-6} .

[76]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

15

R^{10} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{34} es $-S(O)_{m6}R^{33}$; y

20

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

[77]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$.

25

[78]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$;

30

R^{11} es alquilo C_{1-6} ;

35 R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} .

[79]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$;

40

R^{11} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} o alqueno C_{2-6} ;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

45

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano o $-S(O)_{m6}R^{33}$; y

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

50 [80]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$;

55 R^{11} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

R^{34} es $-OR^{33}$; y

60

R^{33} es alquilo C_{1-6} .

[81]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$; y

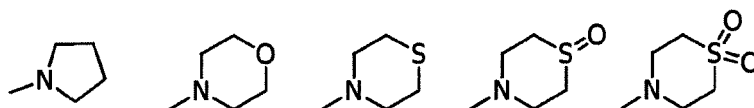
65

R¹¹ forma opcionalmente un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R¹¹ y R¹² están unidos formando una cadena de alquileo C₄₋₅ junto con R¹², y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O) o S(O)₂.

5
[82]

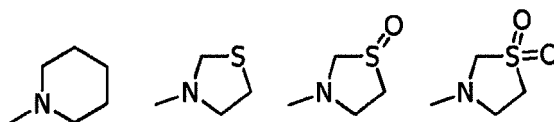
El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es un sustituyente de las siguientes fórmulas estructurales:

10



[83]

15 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es un sustituyente de las siguientes fórmulas estructurales:



20 [84]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p.

25 [85]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, y

30 R⁶ es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p.

[86]

35 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶,

R⁶ es -OR¹³;

40 R¹³ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, y

R³⁴ es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p.

[87]

45 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶,

R⁶ es -S(O)_mR¹⁴;

50 R¹⁴ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, y

R³⁴ es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p.

[88]

55 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -S(O)_mR¹⁰;

R¹⁰ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, y

R³⁴ es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p.

[89]

5 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -N(R¹¹)R¹²;

R¹¹ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴;

10 R¹² es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R³⁴ es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p.

15 [90]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -N(R¹¹)R¹²;

20 R¹¹ es fenilo o fenilo sustituido con (R⁷)_p; y

R¹² es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆.

[91]

25 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [84] a [90], en el que R⁷ es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷ u -OR¹⁵;

30 R¹⁵ es alquilo C₁₋₆;

R²⁷ es un átomo de halógeno, -OR²⁹ o -S(O)_{m4}R³⁰; y

R²⁹ y R³⁰ son cada uno independientemente alquilo C₁₋₆.

35 [92] El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [84] a [90], en el que R⁷ es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷ u -OR¹⁵;

R¹⁵ es alquilo C₁₋₆; y

40 R²⁷ es un átomo de halógeno.

[93]

45 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es uno cualquiera de los heterociclos de U-1 a U-25.

[94]

50 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a.

[95]

55 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -N(R¹¹)R¹²; y

R¹¹ es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19; y

60 R¹² es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆.

[96]

65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es -N(R¹¹)R¹²;

R¹¹ es U-7; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} .

[97]

5 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ; y

10 R^{34} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[98]

15 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ; y

20 R^{34} es U-1, U-3 o U-20 a U-25.

[99]

25 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ; y

30 R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[100]

35 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$;

R^{11} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ; y

40 R^{34} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[101]

45 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$;

R^{11} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ; y

50 R^{34} es U-1, U-3 o U-20 a U-25.

[102]

55 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es $-N(R^{11})R^{12}$;

R^{11} es alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

60 R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[103]

65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo

(C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

R⁶ es -OR¹³;

5 R¹³ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y

R³⁴ es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[104]

10 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

R⁶ es -OR¹³;

15 R¹³ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y

R³⁴ es U-1, U-3 o U-20 a U-25.

20 [105]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

25 R⁶ es -OR¹³;

R¹³ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y

R³⁴ es U-1, U-3 o U-22a.

30 [106]

El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

35 R⁶ es -S(O)_{m2}R¹⁴;

R¹⁴ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y

40 R³⁴ es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[107]

45 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

R⁶ es -S(O)_{m2}R¹⁴;

R¹⁴ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y

50 R³⁴ es U-1, U-3 o U-20 a U-25.

[108]

55 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [1] a [48], en el que R^{1a} es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶;

R⁶ es -S(O)_{m2}R¹⁴;

60 R¹⁴ es alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴; y

R³⁴ es U-1, U-3 o U-22a.

[109]

65 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [93] a [108], en el que t1, t2, t3, t4,

t5, t7, t8 y t9 son cada uno independientemente un número entero de 0.

[110]

5 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [93] a [108], en el que R^{28} es un átomo de halógeno, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , (alcoxilo C_{1-6})-alquilo C_{1-6} , $-OR^{31}$ o $-S(O)_mR^{30}$.

[111]

10 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [93] a [108], en el que R^{28} es un átomo de halógeno.

[112]

15 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [93] a [108], en el que R^{28} es alquilo C_{1-6} .

[113]

20 El compuesto de amida heterocíclico o la sal del mismo según uno cualquiera de [93] a [108], en el que R^{28} es alcoxilo C_{1-6} .

[114]

25 Un producto químico agrícola que comprende uno o dos o más de compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclico y la sal del mismo tal como se describe en uno cualquiera de [1] a [113] como componente activo.

[115]

30 Un herbicida que comprende uno o dos o más de compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclico y la sal del mismo tal como se describe en uno cualquiera de [1] a [113] como componente activo.

35 Efectos de la invención

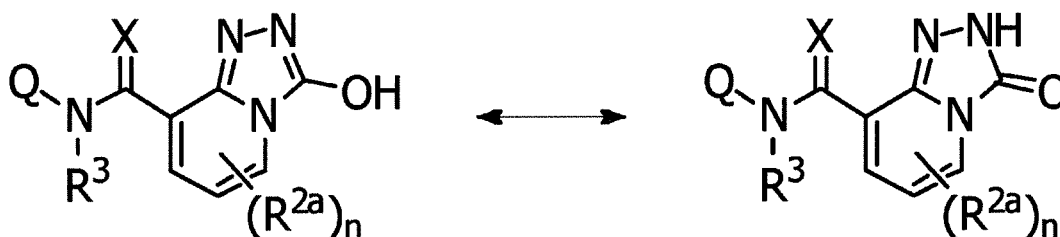
El compuesto de la presente invención tiene una excelente actividad herbicida frente a diversas malas hierbas y tiene un alto nivel de seguridad para los cultivos objetivo. Además, el compuesto de la presente invención casi no tiene efectos adversos sobre criaturas no objetivo tales como mamíferos, peces e insectos beneficiosos y tiene una carga medioambiental ligera debido a propiedades residuales bajas.

40 Por consiguiente, la presente invención puede proporcionar un herbicida útil en los campos agrícolas y hortícolas tales como arrozales, campos de secano y huertos.

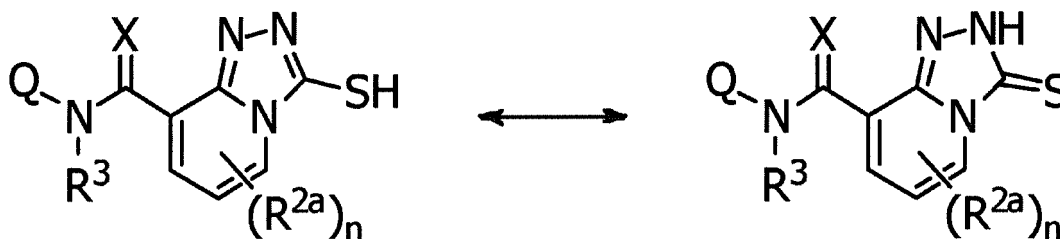
45 Modos para llevar a cabo la invención

Los compuestos incluidos en la presente invención pueden incluir los isómeros geométricos de una forma E y una forma Z dependiendo de los sustituyentes. La presente invención incluye la forma E, la forma Z y una mezcla de la forma E y la forma Z en cualquier razón. Los compuestos incluidos en la presente invención incluyen isómeros ópticamente activos debido a la existencia de uno o dos o más de átomos de carbono asimétricos. La presente invención incluye todos los isómeros ópticamente activos o formas racémicas.

Los compuestos incluidos en la presente invención pueden incluir tautómeros dependiendo de los sustituyentes. La presente invención incluye todos los tautómeros o una mezcla de los tautómeros incluidos en cualquier razón. Por ejemplo, en el caso del compuesto de fórmula (1): [en donde W es W-1; R^{1a} es grupo hidroxilo; n, Q, R^{2a} , R^3 y X significan lo mismo que se describió anteriormente], se incluyen los siguientes tautómeros.



De manera similar, en el caso del compuesto de fórmula (1): [en donde W es W-1; R^{1a} es grupo -SH; n, Q, R^{2a}, R³ y X significan lo mismo que se describió anteriormente], se incluyen los siguientes tautómeros.



Entre los compuestos incluidos en la presente invención, los compuestos que pueden formar sal de adición de ácido mediante un método convencional pueden formar, por ejemplo, las sales de hidrácidos halogenados tales como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico y ácido yodhídrico; las sales de ácidos inorgánicos tales como ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido clórico y ácido perclórico; las sales de ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico, ácido etanosulfónico, ácido trifluorometanosulfónico, ácido bencenosulfónico y ácido p-toluenosulfónico; las sales de ácidos carboxílicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico, ácido maleico, ácido málico, ácido succínico, ácido benzoico, ácido mandélico, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido glucónico y ácido cítrico; o las sales de aminoácidos tales como ácido glutámico y ácido aspártico.

Entre los compuestos incluidos en la presente invención, los compuestos que pueden formar una sal de metal mediante un método convencional pueden formar, por ejemplo, las sales de metales alcalinos tales como litio, sodio y potasio; las sales de metales alcalinotérreos tales como calcio, bario y magnesio; o la sal de aluminio.

A continuación, se describirán ejemplos específicos de cada sustituyente descrito en esta memoria descriptiva. En el presente documento, n- significa normal; i- significa iso; s- significa secundario; y terc- significa terciario y Ph significa fenilo.

Los ejemplos del átomo de halógeno en esta memoria descriptiva pueden incluir un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo. La expresión de "halo" en esta memoria descriptiva es también estos átomos de halógeno.

La expresión de alquilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alquilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo i-propilo, grupo n-butilo, grupo i-butilo, grupo s-butilo, grupo terc-butilo, grupo n-pentilo, grupo 1,1-dimetilpropilo, grupo n-hexilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de cicloalquilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillos condensados de un anillo de 3 miembros a un anillo de 6 miembros. Cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con un grupo alquilo en un intervalo del número de átomos de carbono especificado. Un ejemplo específico del cicloalquilo C_{a-b} puede incluir grupo ciclopropilo, grupo 1-metilciclopropilo, grupo 2-metilciclopropilo, grupo 2,2-dimetilciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo y similares. Cada uno de estos grupos de selección en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de halocicloalquilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillos condensados de un anillo de 3 miembros a un anillo de 10 miembros. Cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con un grupo alquilo en un intervalo del número de átomos de carbono especificado. La posición de sustitución con el átomo de halógeno puede estar en una parte de la estructura de anillo, en una parte de la estructura de cadena lateral, o en ambas de ellas. Cuando se usan dos o más átomos de halógeno como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del halocicloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-difluorociclopropilo, grupo 2,2-diclorociclopropilo, grupo 2,2-dibromociclopropilo, grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilo, grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilo, grupo 2,2,3,3-tetra-fluorociclobutilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de alqueno C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más dobles enlaces en la molécula. Los ejemplos específicos del alqueno C_{a-b} pueden incluir grupo vinilo, grupo 1-propenilo, grupo 2-propenilo, grupo

1-metiletenilo, grupo 2-butenilo, grupo 2-metil-2-propenilo, grupo 3-metil-2-butenilo, grupo 1,1-dimetil-2-propenilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

5 La expresión de haloalqueno C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno y que tiene uno o dos o más dobles enlaces en la molécula. En este caso, cuando se usan dos o más átomos de halógeno como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalqueno C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-diclorovinilo, grupo 2-fluoro-2-propenilo, grupo 2-cloro-2-propenilo, grupo 3-cloro-2-propenilo, grupo 2-bromo-2-propenilo, grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, 2,3-dicloro-2-propenilo, grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, grupo 2,3,3-trifluoro-2-propenilo, grupo 2,3,3-tricloro-2-propenilo, grupo 1-(trifluorometil)etenilo, grupo 4,4-difluoro-3-butenilo, grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

15 La expresión de cicloalqueno C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo insaturado cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más dobles enlaces y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillos condensados de un anillo de 3 miembros a un anillo de 6 miembros. Cada anillo puede estar sustituido con un grupo alquilo en un intervalo del número de átomos de carbono especificado. El doble enlace puede estar o bien en forma endo o bien en forma exo. Los ejemplos específicos del cicloalqueno C_{a-b} pueden incluir grupo 1-ciclopenten-1-ilo, grupo 2-ciclopenten-1-ilo, grupo 1-ciclohexen-1-ilo, grupo 2-ciclohexen-1-ilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

25 La expresión de alquino C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más triples enlaces en la molécula. Los ejemplos específicos del alquino C_{a-b} pueden incluir grupo etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo, grupo 1,1-dimetil-2-propinilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

30 La expresión de haloalquino C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno y que tiene uno o dos o más triples enlaces en la molécula. En este caso, cuando se usan dos o más átomos de halógeno como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalquino C_{a-b} pueden incluir grupo 2-cloroetinilo, grupo 2-bromoetinilo, grupo 2-yodoetinilo, grupo 3-cloro-2-propinilo, grupo 3-bromo-2-propinilo, grupo 3-yodo-2-propinilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

40 La expresión de haloalquilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno. Cuando se usan dos o más átomos de halógeno como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo fluorometilo, grupo clorometilo, grupo bromometilo, grupo yodometilo, grupo difluorometilo, grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, grupo clorodifluorometilo, grupo triclorometilo, grupo bromodifluorometilo, grupo 2-fluoroetilo, grupo 2-cloroetilo, grupo 2-bromoetilo, grupo 2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilo, grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-tricloroetilo, grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, grupo 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilo, grupo pentafluoroetilo, grupo 3,3,3-trifluoropropilo, grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, grupo 1,1,2,3,3,3-hexafluoropropilo, grupo heptafluoropropilo, grupo 2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etilo, grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo, grupo 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutilo, grupo nonafluorobutilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

55 La expresión de alcoxilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo alquil-O- en el que este alquilo es el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alcoxilo C_{a-b} pueden incluir grupo metoxilo, grupo etoxilo, grupo n-propiloxilo, grupo i-propiloxilo, grupo n-butiloxilo, grupo i-butiloxilo, grupo s-butiloxilo, grupo terc-butiloxilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

60 La expresión de alquiltio C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo alquil-S- en el que este alquilo es el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alquiltio C_{a-b} pueden incluir grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo i-propiltio, grupo n-butiltio, grupo i-butiltio, grupo s-butiltio, grupo terc-butiltio y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

65 La expresión de alquilcarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo alquil-C(O)- en el que este alquilo es el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alquilcarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo acetilo, grupo propionilo, grupo butirilo, grupo isobutirilo, grupo valerilo,

grupo isovalerilo, grupo 2-metilbutanoilo, grupo pivaloilo, grupo hexanoilo, grupo heptanoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de haloalquilcarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo haloalquil-C(O)- en el que este haloalquilo es el grupo haloalquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del haloalquilcarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo fluoroacetilo, grupo cloroacetilo, grupo difluoroacetilo, grupo dicloroacetilo, grupo trifluoroacetilo, grupo clorodifluoroacetilo, grupo bromodifluoroacetilo, grupo tricloroacetilo, grupo pentafluoropropionilo, grupo heptafluorobutanoilo, grupo 3-cloro-2,2-dimetilpropanoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de cicloalquilcarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo cicloalquil-C(O)- en el que este cicloalquilo es el grupo cicloalquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del cicloalquilcarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo ciclopropilcarbonilo, grupo 2-metilciclopropilcarbonilo, grupo ciclobutilcarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de halocicloalquilcarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo halocicloalquil-C(O)- en el que este halocicloalquilo es el halocicloalquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del halocicloalquilcarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-diclorociclopropilcarbonilo, grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilcarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de alcóxicarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo alquil-O-C(O)- en el que este alquilo es el alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alcóxicarbonilo C_{a-b} pueden incluir un grupo metóxicarbonilo, grupo etóxicarbonilo, grupo n-propilóxicarbonilo, grupo i-propilóxicarbonilo, grupo n-butoxicarbonilo, grupo i-butoxicarbonilo, grupo terc-butoxicarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de haloalcoxycarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo haloalquil-O-C(O)- en el que este haloalquilo es el grupo haloalquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del haloalcoxycarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo clorometóxicarbonilo, grupo 2-cloroetóxicarbonilo, grupo 2,2-difluoroetóxicarbonilo, grupo 2,2,2-trifluoroetóxicarbonilo, grupo 2,2,2-tricloroetóxicarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de alquilaminocarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo carbamoilo en el que un átomo de hidrógeno se sustituye con el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alquilaminocarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilcarbamoilo, grupo etilcarbamoilo, grupo n-propilcarbamoilo, grupo i-propilcarbamoilo, grupo n-butilcarbamoilo, grupo i-butilcarbamoilo, grupo s-butilcarbamoilo, grupo terc-butilcarbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de haloalquilaminocarbonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo carbamoilo en el que un átomo de hidrógeno se sustituye con el grupo haloalquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del haloalquilaminocarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2-fluoroetilcarbamoilo, grupo 2-cloroetilcarbamoilo, grupo 2,2-difluoroetilcarbamoilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilcarbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de di(alquil C_{a-b})aminocarbonilo en esta memoria descriptiva es un grupo carbamoilo en el que ambos átomos de hidrógeno se sustituyen con grupos alquilo de significado anterior, que son iguales o diferentes entre sí, que tienen un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del di(alquil C_{a-b})aminocarbonilo pueden incluir grupo N,N-dimetilcarbamoilo, grupo N-etil-N-metilcarbamoilo, grupo N,N-dietilcarbamoilo, grupo N,N-di(n-propil)carbamoilo, grupo N,N-di(n-butil)carbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de alquilaminosulfonilo C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo sulfamoilo en el que un átomo de hidrógeno se sustituye con el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alquilaminosulfonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilsulfamoilo, grupo etilsulfamoilo, grupo n-propilsulfamoilo, grupo i-propilsulfamoilo, grupo n-butilsulfamoilo, grupo i-butilsulfamoilo, grupo s-butilsulfamoilo, grupo terc-butilsulfamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

La expresión de di(alquil C_{a-b})aminosulfonilo en esta memoria descriptiva es un grupo sulfamoilo en el que ambos átomos de hidrógeno se sustituyen con los grupos alquilo de significado anterior, que son iguales o diferentes entre sí, que tienen un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del di(alquil C_{a-b})aminosulfonilo pueden incluir grupo N,N-dimetilsulfamoilo, grupo N-etil-N-metilsulfamoilo, grupo N,N-dietilsulfamoilo, grupo N,N-

di(n-propil)sulfamoilo, grupo N,N-di(n-butil)sulfamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

5 La expresión de alquilamino C_{a-b} en esta memoria descriptiva es un grupo amino en el que un átomo de hidrógeno se sustituye con el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del alquilamino C_{a-b} pueden incluir grupo metilamino, grupo etilamino, grupo n-propilamino, grupo i-propilamino, grupo n-butilamino, grupo i-butilamino, grupo terc-butilamino y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

10 La expresión de di(alquil C_{a-b})amino en esta memoria descriptiva es un grupo amino en el que ambos átomos de hidrógeno se sustituyen con los grupos alquilo de significado anterior, que son iguales o diferentes entre sí, que tienen un número de átomos de carbono de a a b. Los ejemplos específicos del di(alquil C_{a-b})amino pueden incluir grupo dimetilamino, grupo etil(metil)amino, grupo dietilamino, grupo n-propil(metil)amino, grupo i-propil(metil)amino, grupo di(n-propil)amino, grupo di(n-butil)amino y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

15 La expresión de alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^6 , alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{34} , alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{35} o alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{36} en esta memoria descriptiva es el grupo alquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que los átomos de hidrógeno unidos a los átomos de carbono están opcionalmente sustituidos con cualquiera de R^6 , R^{27} , R^{34} , R^{35} o R^{36} . Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado. En este caso, cuando dos o más de sustituyentes R^6 , R^{27} , R^{34} , R^{35} o R^{36} están contenidos en el grupo alquilo (C_{a-b}), R^6 , R^{27} , R^{34} , R^{35} o R^{36} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí.

20 La expresión de cicloalquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^6 o cicloalquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{27} en esta memoria descriptiva es el grupo cicloalquilo de significado anterior que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que los átomos de hidrógeno unidos a los átomos de carbono están opcionalmente sustituidos con cualquiera de R^6 o R^{27} . Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado. En este caso, cuando dos o más de los sustituyentes R^6 o R^{27} están contenidos en el grupo cicloalquilo (C_{a-b}), R^6 o R^{27} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Las posiciones sustituidas pueden estar en una parte de estructura de anillo, en una parte de estructura de cadena lateral o en ambas de ellas.

25 Los ejemplos específicos de la expresión de " R^{11} forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileo C_{2-6} junto con R^{12} , y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo", " R^{11a} forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquileo C_{2-6} junto con R^{12a} , y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo" y " R^{21} forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de alquileo C_{2-6} junto con R^{22} , en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O S, S(O), S(O)₂ o N(R^{39}) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo" en esta memoria descriptiva pueden incluir aziridina, azetidina, azetidina-2-ona, pirrolidina, pirrolidina-2-ona, oxazolidina, oxazolidin-2-ona, oxazolidin-2-tiona, tiazolidina, tiazolidin-2-ona, tiazolidin-2-tiona, imidazolidina, imidazolidin-2-ona, imidazolidin-2-tiona, piperidina, piperidin-2-ona, piperidin-2-tiona, 2H-3,4,5,6-tetrahidro-1,3-oxazin-2-ona, 2H-3,4,5,6-tetrahidro-1,3-oxazin-2-tiona, morfolina, 2H-3,4,5,6-tetrahidro-1,3-tiazin-2-ona, 2H-3,4,5,6-tetrahidro-1,3-tiazin-2-tiona, tiomorfolina, 1-óxido de tiomorfolina, 1,1-dióxido de tiomorfolina, perhidropirimidin-2-ona, piperazina, homopiperidina, homopiperidin-2-ona, heptametilimina y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

30 La expresión de (alcoxi C_{a-b})-alquilo C_{d-e} , (alquilitio C_{a-b})-alquilo C_{d-e} , o similar en esta memoria descriptiva es un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de d a e en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con cualquiera del grupo alcoxi C_{a-b} o grupo alquilitio C_{a-b} de significado anterior respectivamente. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número de átomos de carbono especificado.

35 El "heterociclo aromático de 5-6 miembros" en esta memoria descriptiva significa un heterociclo aromático monocíclico en el que el número de átomos que forman el anillo es de 5 a 6 y están contenidos de 1 a 5 heteroátomos (el heteroátomo significa un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre) en los átomos que forman el anillo. Los ejemplos específicos del heterociclo aromático de 5-6 miembros pueden incluir pirrol, pirazol, imidazol, triazol, tetrazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, triazina, furano, tiofeno, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiadiazol y similares.

40 Cuando el "heterociclo aromático de 5-6 miembros" contiene un doble enlace C=N, el átomo de nitrógeno puede ser N-óxido.

El "heteroarilo de 5-6 miembros" en esta memoria descriptiva significa un sustituyente monovalente formado eliminando un átomo de hidrógeno de cualquier posición en el "heterociclo aromático de 5-6 miembros" de significado anterior. Las posiciones a las que estos sustituyentes se unen no están particularmente limitadas y los sustituyentes pueden unirse a posiciones deseadas.

El "heterociclo no aromático de 3-7 miembros" en esta memoria descriptiva significa un heterociclo no aromático monocíclico que tiene las siguientes características:

- 1) el número de átomos que forman el anillo es de 3 a 7,
- 2) están contenidos de 1 a 3 heteroátomos (el heteroátomo significa un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre) en los átomos que forman el anillo,
- 3) puede estar contenido un grupo carbonilo, un grupo tiocarbonilo, un doble enlace o un triple enlace en el anillo, y
- 4) cuando está contenido un átomo de azufre en los átomos que forman el anillo, el átomo de azufre puede ser un grupo sulfinilo o un grupo sulfonilo.

Los ejemplos específicos del heterociclo no aromático de 3-7 miembros pueden incluir azetidina, pirrolidina, pirrolidinona, oxazolidina, isoxazolidina, tiazolidina, isotiazolidina, piperazina, piperazinona, piperidina, piperidinona, morfolina, tiomorfolina, azepina, diazepina, oxetano, tetrahidrofurano, 1,3-dioxolano, tetrahidropirano, 1,4-dioxano, oxepano, homomorfolina y similares.

El "heterociclilo de 3-7 miembros" en esta memoria descriptiva significa un sustituyente monovalente formado eliminando un átomo de hidrógeno de cualquier posición en el "heterociclo no aromático de 3-7 miembros" de significado anterior. Las posiciones a las que estos sustituyentes se unen no están particularmente limitadas y los sustituyentes pueden unirse a posiciones deseadas.

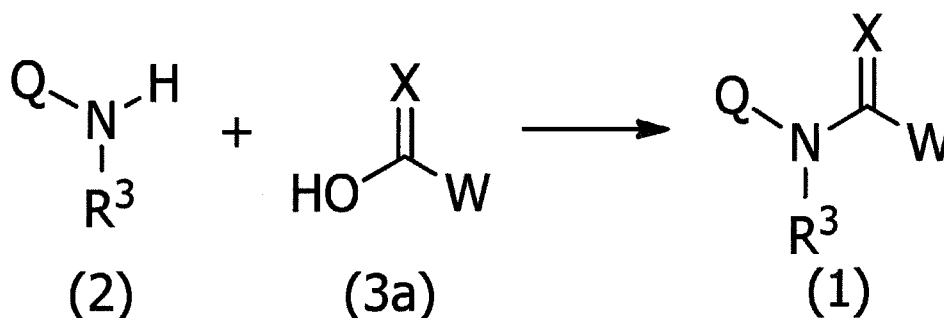
El "heteroarilo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a} " en esta memoria descriptiva es un "heteroarilo de 5-6 miembros" en el que los átomos de hidrógeno en los átomos de carbono que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" se sustituyen en los átomos de carbono con cualquier R^{28} en un intervalo del número de los átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existe nitrógeno entre los átomos que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" y el átomo de nitrógeno tiene potencialmente una estructura NH, el "heteroarilo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a} " es un "heteroarilo de 5-6 miembros" en el que el átomo de hidrógeno en el átomo de nitrógeno está opcionalmente sustituido en el átomo de nitrógeno con cualquier R^{28a} en un intervalo del número de átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando dos o más sustituyentes R^{28} en los átomos de carbono que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" y dos o más sustituyentes R^{28a} sustituidos con el átomo de nitrógeno que tiene potencialmente una estructura NH que forman el anillo existen independientemente, dos o más de cada uno de R^{28} y R^{28a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando $-CH=CH-CH=CH-$.

El "heterociclilo de 3-7 miembros opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a} " en esta memoria descriptiva es un "heterociclilo de 3-7 miembros" en el que los átomos de hidrógeno en los átomos de carbono que forman el anillo del "heterociclilo de 3-7 miembros" se sustituyen en los átomos de carbono con cualquier R^{28} en un intervalo del número de los átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existe nitrógeno entre los átomos que forman el anillo del "heterociclilo de 3-7 miembros" y el átomo de nitrógeno tiene potencialmente una estructura NH, el "heterociclilo de 3-7 miembros opcionalmente sustituido con R^{28a} " es un "heterociclilo de 3-7 miembros" en el que el átomo de hidrógeno en el átomo de nitrógeno está opcionalmente sustituido en el átomo de nitrógeno con cualquier R^{28a} en un intervalo del número de átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando dos o más sustituyentes R^{28} en los átomos de carbono que forman el anillo del "heterociclilo de 3-7 miembros" y dos o más sustituyentes R^{28a} sustituidos con el átomo de nitrógeno que tiene potencialmente una estructura NH que forman el anillo existen independientemente, dos o más de cada uno de R^{28} y R^{28a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando $-CH=CH-CH=CH-$.

Seguidamente, a continuación, se describirá el método de producción del compuesto de la presente invención.

Método de producción A

El compuesto de amida heterocíclico de fórmula (1) puede producirse, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (2) con el compuesto de fórmula (3a).



5 El compuesto de fórmula (1): [en donde Q y R³, W y X significan lo mismo que se definió anteriormente] de la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (2): [en donde Q y R³ significan lo mismo que se definió anteriormente] o la sal del mismo con el compuesto de fórmula (3a): [en donde W y X significan lo mismo que se definió anteriormente] o la sal del mismo en un disolvente o sin usar un disolvente usando una base, un agente de condensación y/o un catalizador si es necesario y añadiendo un aditivo si es necesario.

10 En esta reacción, el compuesto de fórmula (3a) puede usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 100 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (2).

15 Cuando se usa el disolvente, el disolvente que va a usarse puede ser un disolvente que es inactivo para la reacción. Los ejemplos del disolvente pueden incluir disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como dietil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano y difenil éter; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos disolventes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.

20 Cuando se usa la base, los ejemplos de la base que va a usarse pueden incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio. Estas bases pueden usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (2).

25 Cuando se usa el agente de condensación, los ejemplos del agente de condensación que va a usarse pueden incluir hexafluorofosfato de 1H-benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio, N,N'-díciclohexilcarbodiimida, clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio. Estos agentes de condensación pueden usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (2).

30 Cuando se usa el aditivo, los ejemplos del aditivo que va a usarse pueden incluir 3H-[1,2,3]triazolo[4,5-b]piridin-3-ol y 1-hidroxibenzotriazol. Estos aditivos pueden usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (2).

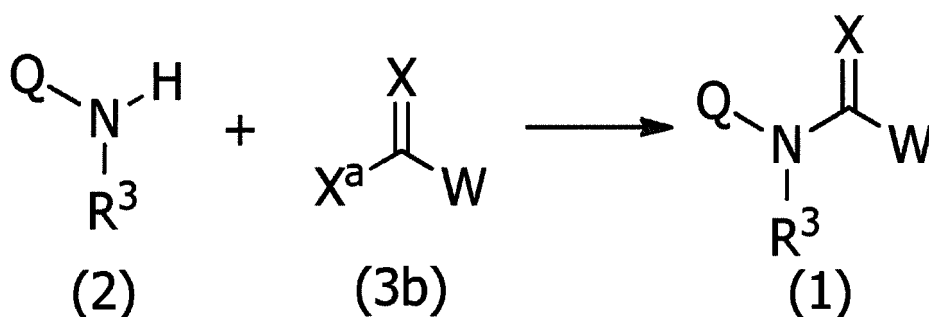
35 Como temperatura de reacción, puede fijarse cualquier temperatura desde -78°C hasta la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, habitualmente puede fijarse cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

40 Algunos de los compuestos de fórmula (2) son compuestos conocidos y algunos de los compuestos están disponibles comercialmente.

45 Algunos de los compuestos de fórmula (3a) son compuestos conocidos y pueden sintetizarse según métodos conocidos descritos en documentos. Los ejemplos de los métodos conocidos en los documentos pueden incluir un método descrito en el documento WO 2008/006540.

Método de producción B

50 El compuesto de amida heterocíclico de fórmula (1) puede producirse, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (2) con el compuesto de fórmula (3b).



El compuesto de fórmula (1): [en donde Q y R³, W y X significan lo mismo que se definió anteriormente] de la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (2): [en donde Q y R³ significan lo mismo que se definió anteriormente] o la sal del mismo con el compuesto de fórmula (3b): [en donde W y X significan lo mismo que se definió anteriormente y X^a es un grupo saliente tal como un átomo de halógeno] o la sal del mismo en un disolvente o sin usar un disolvente usando una base si es necesario.

En esta reacción, el compuesto de fórmula (3b) puede usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 100 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (2).

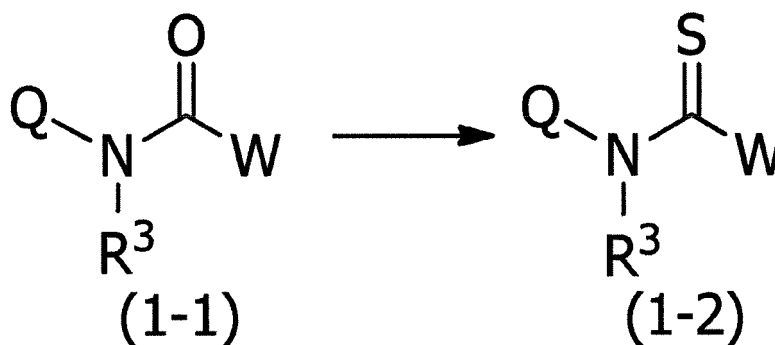
Cuando se usa el disolvente, el disolvente que va a usarse puede ser un disolvente que es inactivo para la reacción. Los ejemplos del disolvente pueden incluir disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como dietil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano y difenil éter; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos disolventes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.

Cuando se usa la base, los ejemplos de la base que va a usarse pueden incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, carbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio e hidruro de sodio. Estas bases pueden usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (2). Estas bases pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de las mismas.

Como temperatura de reacción, puede fijarse cualquier temperatura desde -78°C hasta la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, habitualmente puede fijarse cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Método de producción C

El compuesto de fórmula (1-2): [en donde W, Q y R³ significan lo mismo que se definió anteriormente] de la presente invención puede producirse, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (1-1): [en donde W, Q y R³ significan lo mismo que se definió anteriormente] de la presente invención con agentes de sulfidización tales como pentasulfuro de fósforo, pentasulfuro de fósforo-HMDO (hexametildisiloxano) y reactivo de Lawesson (2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiazolidio-2,4-disulfuro).



El agente de sulfidización usado en esta reacción puede usarse en un intervalo de 0,5 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (1-1).

Pueden usarse si es necesario bases tales como carbonato de potasio, trietilamina, piridina y 4-(dimetilamino)piridina.

Esta reacción puede llevarse a cabo sin usar un disolvente. Sin embargo, puede usarse un disolvente. Los ejemplos del disolvente pueden incluir disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona y agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, 2-propanol y etilenglicol; éteres tales como dietil éter, tetrahidrofurano y difenil éter; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroforno y tetracloruro de carbono; e hidrocarburos alifáticos tales como pentano y n-hexano. Estos disolventes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.

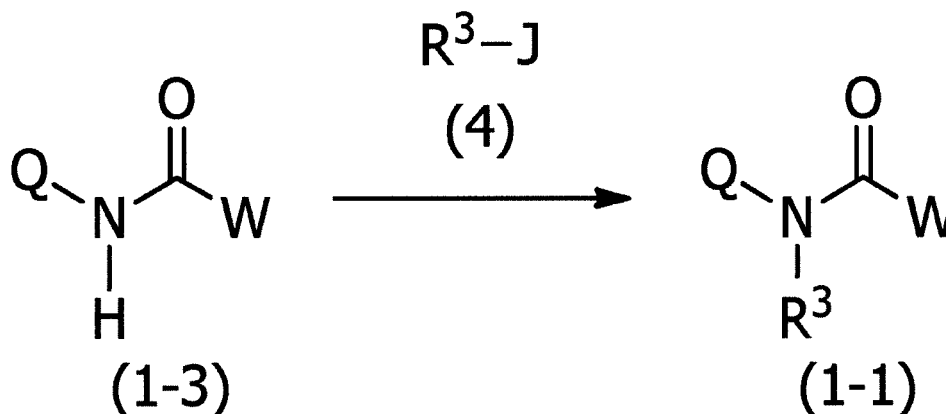
Como temperatura de reacción, puede fijarse cualquier temperatura desde -60°C hasta la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, habitualmente puede fijarse cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

En el método de producción A al método de producción C, un tratamiento posterior habitual de la mezcla de reacción tras la finalización de la reacción tal como concentración directa, concentración tras disolver en un disolvente orgánico y lavar con agua, o concentración tras verter en hielo-agua y extraer con un disolvente orgánico puede dar el compuesto de la presente invención. Cuando se requiere purificación, el compuesto puede separarse y purificarse mediante cualquier método de purificación tal como recristalización, cromatografía en columna, cromatografía en capa fina y cromatografía de líquidos.

Parte del compuesto de fórmula (3b) puede sintetizarse según la fórmula de reacción 1 descrita a continuación.

Método de producción D

El compuesto de amida heterocíclico de fórmula (1-1) puede producirse, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (1-3): [en donde W y Q significan lo mismo que se definió anteriormente] con el compuesto de fórmula (4): [en donde R^3 tiene el mismo significado que se definió anteriormente y J es un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, $-\text{OH}$, $-\text{OSO}_2\text{Me}$ y $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$].



En esta reacción, el compuesto de fórmula (4) puede usarse en un intervalo de 0,5 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (1-3). Pueden usarse si es necesario ácidos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido p-toluenosulfónico o bases tales como carbonato de potasio, trietilamina, piridina y 4-(dimetilamino)piridina, hidruro de sodio, hidróxido de sodio e hidróxido de potasio. Alternativamente, puede usarse la reacción de Mitsunobu usando azodicarboxilato de dietilo, trifenilfosfina, y similares.

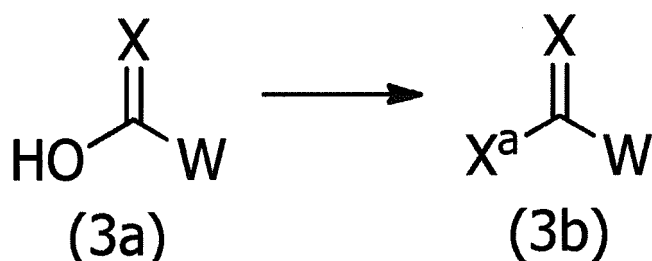
Esta reacción puede llevarse a cabo sin usar un disolvente. Sin embargo, puede usarse un disolvente. Los ejemplos del disolvente pueden incluir disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona y agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, 2-propanol y etilenglicol; éteres tales como dietil éter, tetrahidrofurano y difenil éter; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroforno y tetracloruro de carbono; e hidrocarburos alifáticos tales como pentano y n-hexano. Estos disolventes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.

Como temperatura de reacción, puede fijarse cualquier temperatura desde -60°C hasta la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, habitualmente puede fijarse cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Algunos de los compuestos de fórmula (4) son compuestos conocidos y algunos de los compuestos están disponibles comercialmente. Pueden sintetizarse compuestos distintos de los compuestos descritos anteriormente según métodos descritos en documentos de referencia.

Fórmula de reacción 1

5 El compuesto de fórmula (3b) puede producirse, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (3a) con un agente de halogenación.



10 El compuesto de fórmula (3b): [en donde W, X y X^a significan lo mismo que se definió anteriormente] puede producirse haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (3a) [en donde W y X significan lo mismo que se definió anteriormente] o la sal del mismo con el agente de halogenación en un disolvente o sin usar un disolvente usando una base si es necesario.

15 Los ejemplos del agente de halogenación pueden incluir cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo y cloruro de fosforilo. El agente de halogenación puede usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 100 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (3a).

20 Cuando se usa el disolvente, el disolvente que va a usarse puede ser un disolvente que es inactivo para la reacción. Los ejemplos del disolvente pueden incluir disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como dietil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano y difenil éter; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos disolventes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.

25 Cuando se usa la base, los ejemplos de la base que va a usarse pueden incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, carbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio e hidruro de sodio. Estas bases pueden usarse en un intervalo de 0,1 equivalentes a 50 equivalentes en relación con 1 equivalente del compuesto de fórmula (3a).
30 Estas bases pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de las mismas.

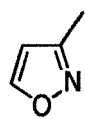
35 Como temperatura de reacción, puede fijarse cualquier temperatura desde -78°C hasta la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, habitualmente puede fijarse cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

El tratamiento posterior habitual para la mezcla de reacción tras la finalización de la reacción puede dar un producto intermedio de producción que sirve como compuesto de material de partida para el método de producción B.

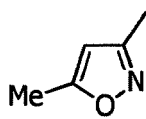
40 El producto intermedio de producción producido mediante este método puede usarse en la siguiente etapa sin aislamiento y purificación.

45 Los ejemplos específicos del compuesto activo incluido en la presente invención pueden incluir los compuestos enumerados en la primera tabla a la tercera tabla. Sin embargo, los compuestos enumerados en la primera tabla a la tercera tabla son compuestos para ejemplificación, y por tanto la presente invención no se limita a estos compuestos. En las tablas, el sustituyente descrito como Me es grupo metilo. De manera similar en las tablas, Et es grupo etilo, n-Pr y Pr-n son cada uno grupo propilo normal, i-Pr y Pr-i son cada uno grupo iso-propilo, c-Pr y Pr-c son cada uno grupo ciclopropilo, n-Bu y Bu-n son cada uno grupo butilo normal, s-Bu y Bu-s son cada uno grupo butilo secundario, un i-Bu y Bu-i son cada uno grupo iso-butilo, t-Bu y Bu-t son cada uno grupo butilo terciario, c-Bu y Bu-c son cada uno grupo ciclobutilo, n-Pen y Pen-n son cada uno grupo pentilo normal, i-Pen y Pen-i son cada uno grupo iso-pentilo, s-Pen y Pen-s son cada uno grupo pentilo secundario, t-Pen y Pen-t son cada uno grupo pentilo terciario, c-Pen y Pen-c son cada uno grupo ciclopentilo, 3-Pen es grupo -CH(Et)₂, n-Hex y Hex-n son cada uno grupo hexilo normal, c-Hex y Hex-c son cada uno ciclohexilo y Ph es grupo fenilo.

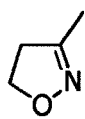
55 En las tablas, las estructuras de D-3, D-3a, D-4, D-4a, D-4b, D-8, D-8a, D-8b, D-8c, D-8d, D-8e, D-8f, D-8g, D-8h, D-9, D-9a, D-9b, D-9c, D-9d, D-9e, D-9f, D-9g, D-9h, D-9i, D-9j, D-9k, D-9m, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-15, D-16, D-16a, D-16b, D-16c, D-16d, D-16e, D-16f, D-16g, D-16h, D-16i, D-16j, D-16k, D-16m, D-16n, D-16p, D-17, D-17a, D-17b, D-18, D-19, D-21, D-24a, D-24b, D-24c, D-24d, D-24e y D-24f son las siguientes estructuras.



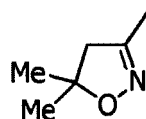
D-3



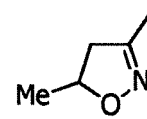
D-3a



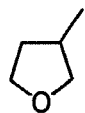
D-4



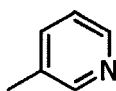
D-4a



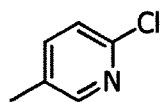
D-4b



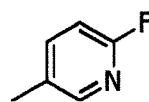
D-5



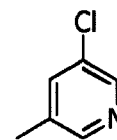
D-8



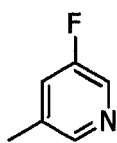
D-8a



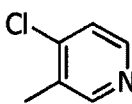
D-8b



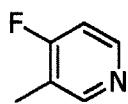
D-8c



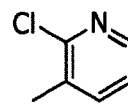
D-8d



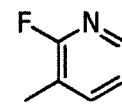
D-8e



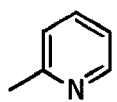
D-8f



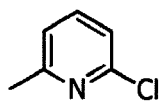
D-8g



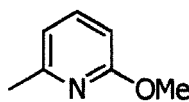
D-8h



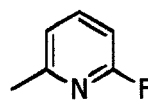
D-9



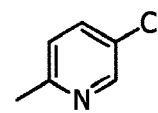
D-9a



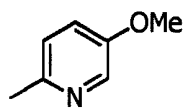
D-9b



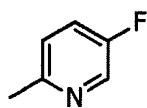
D-9c



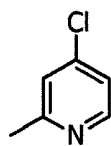
D-9d



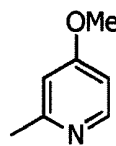
D-9e



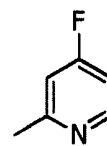
D-9f



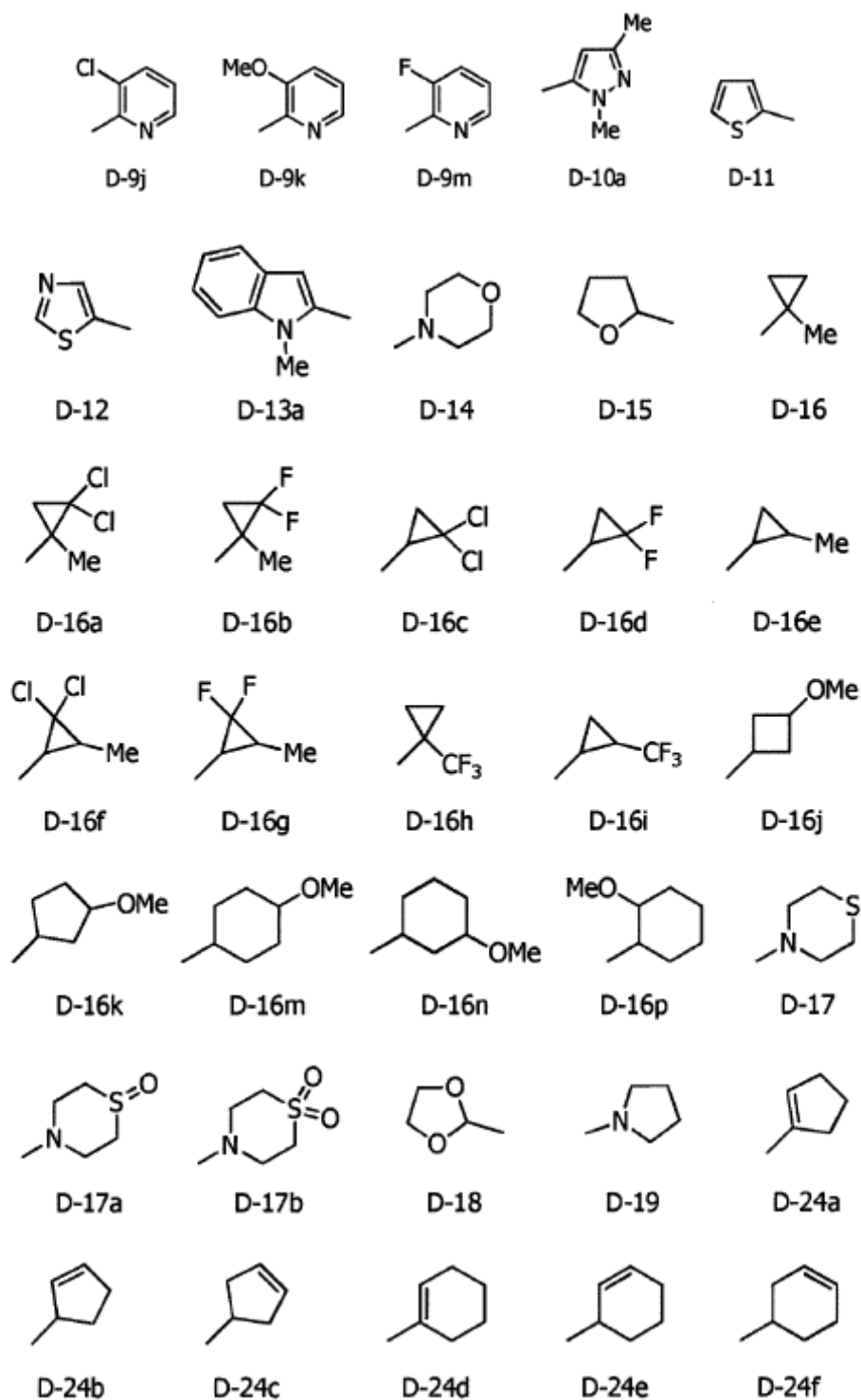
D-9g



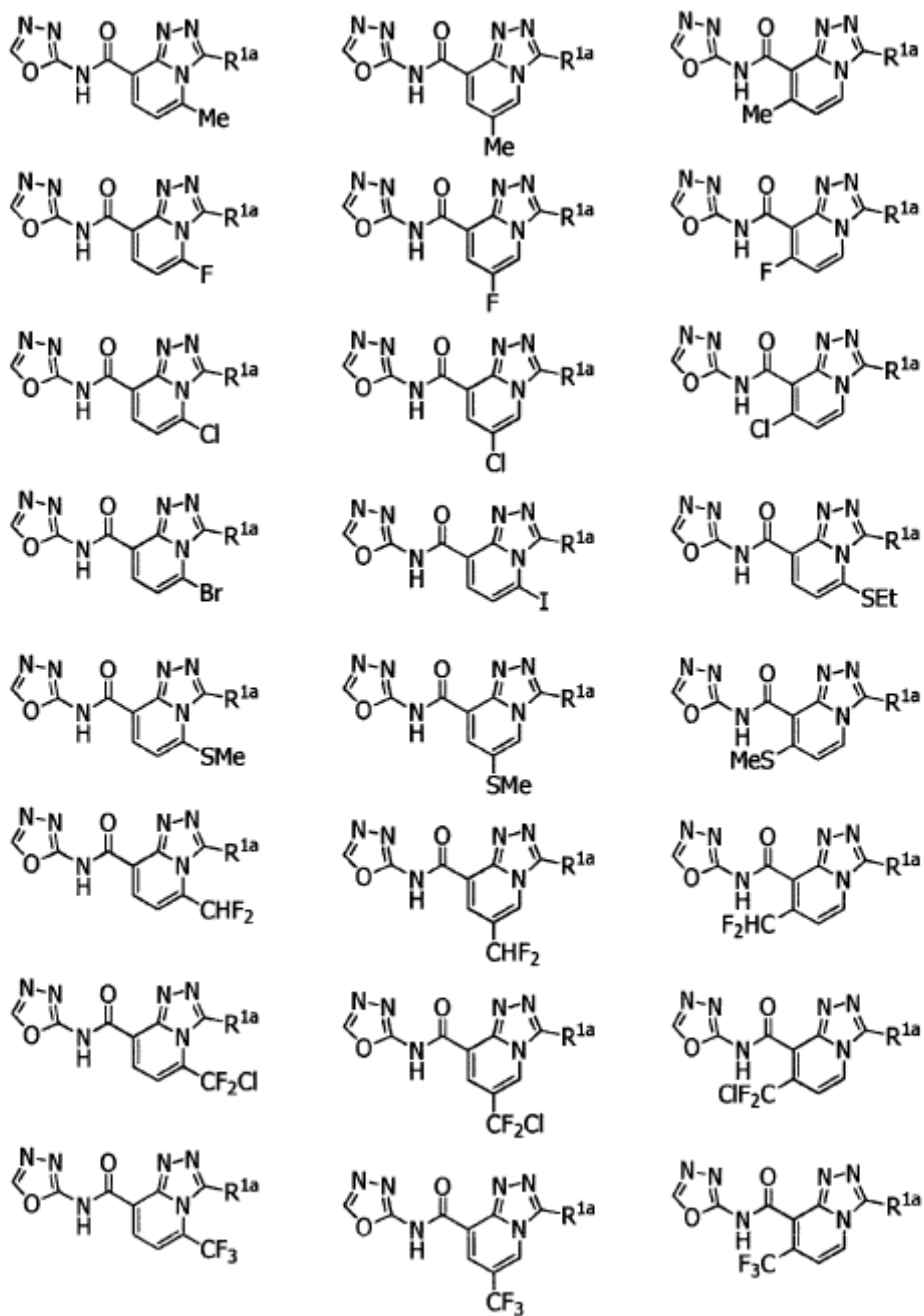
D-9h

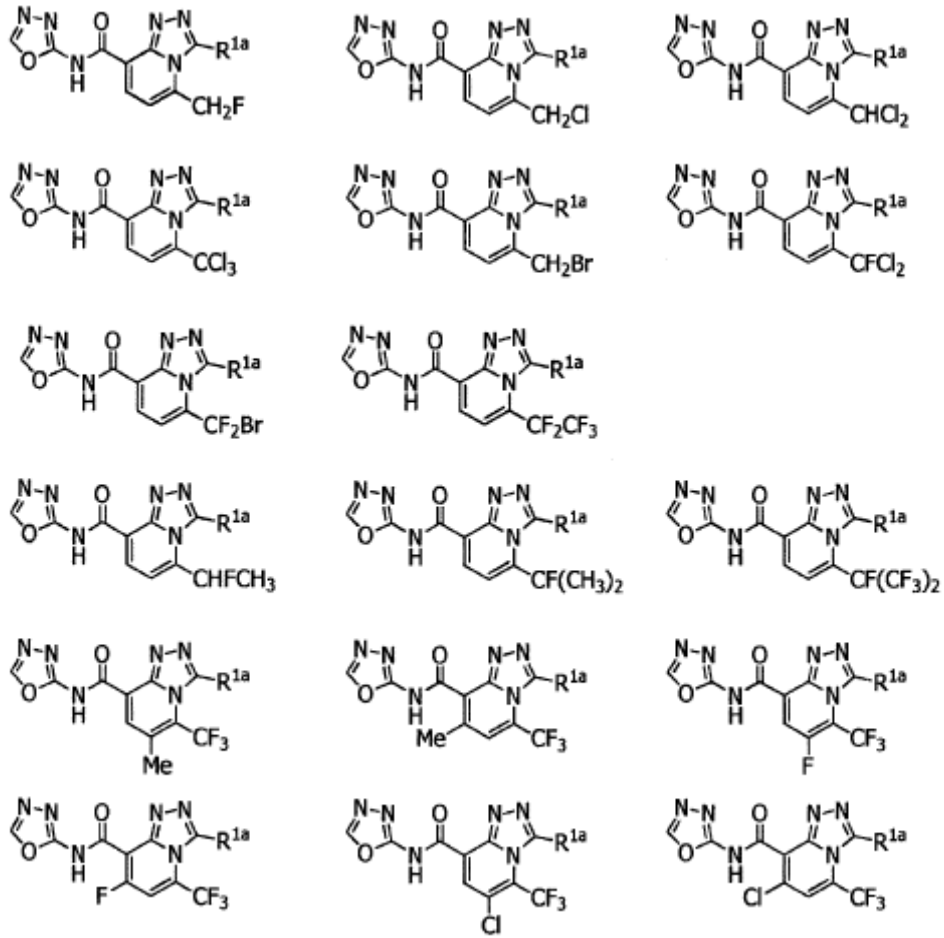


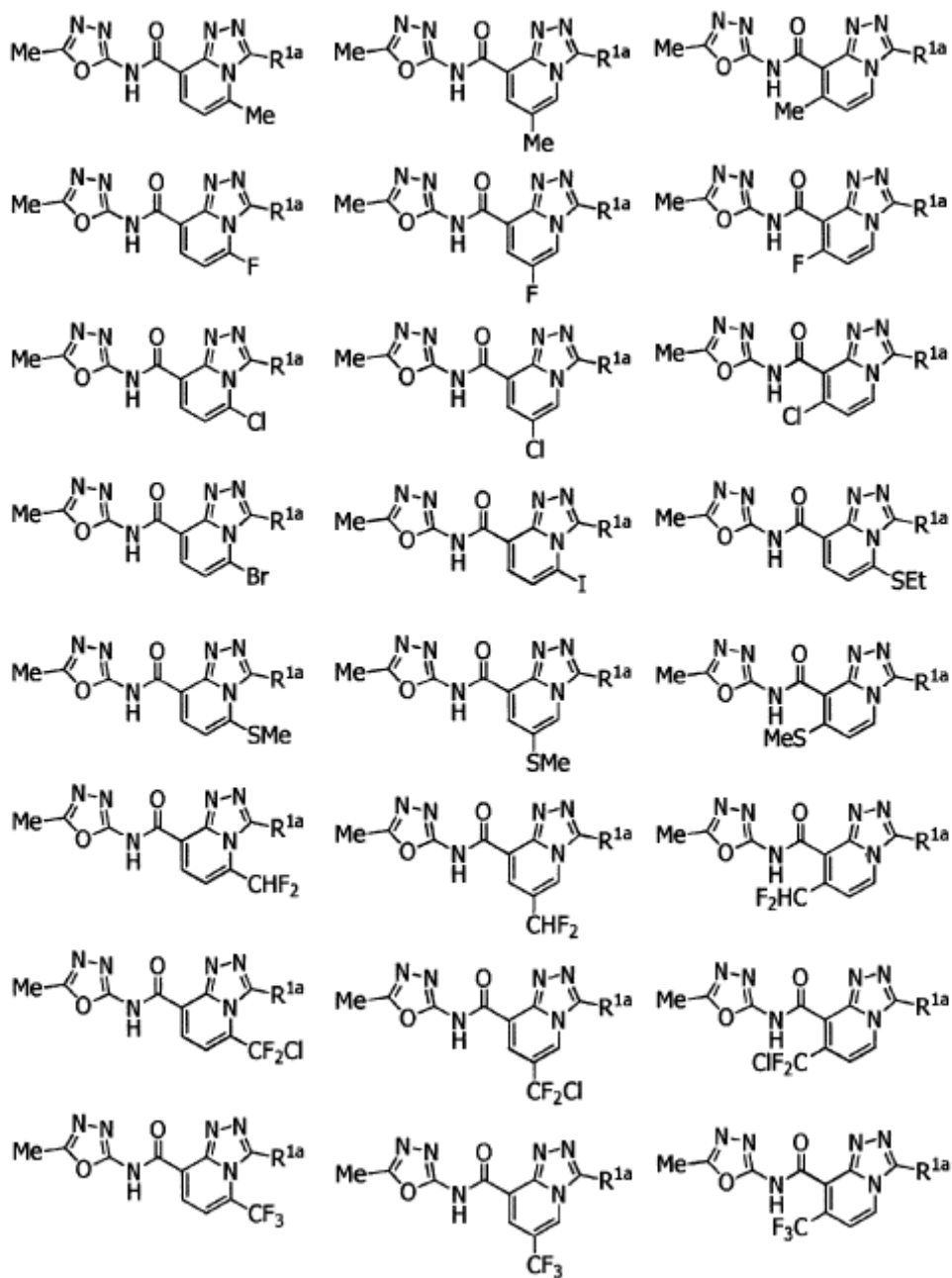
D-9i

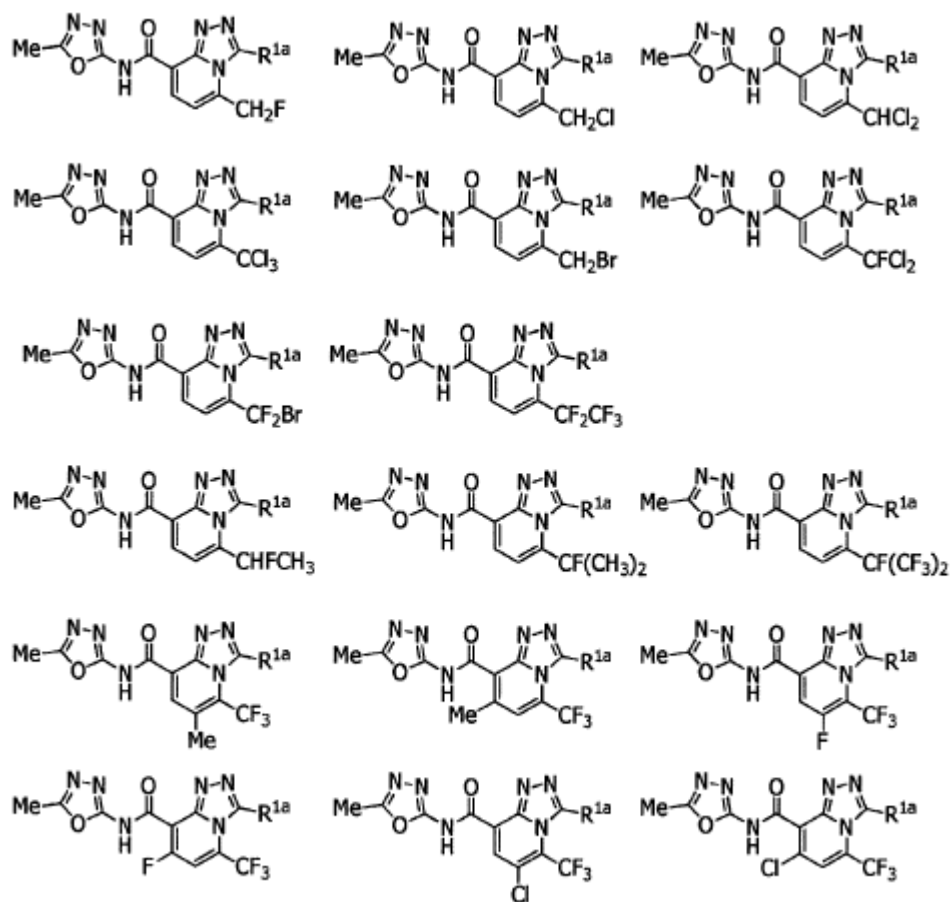


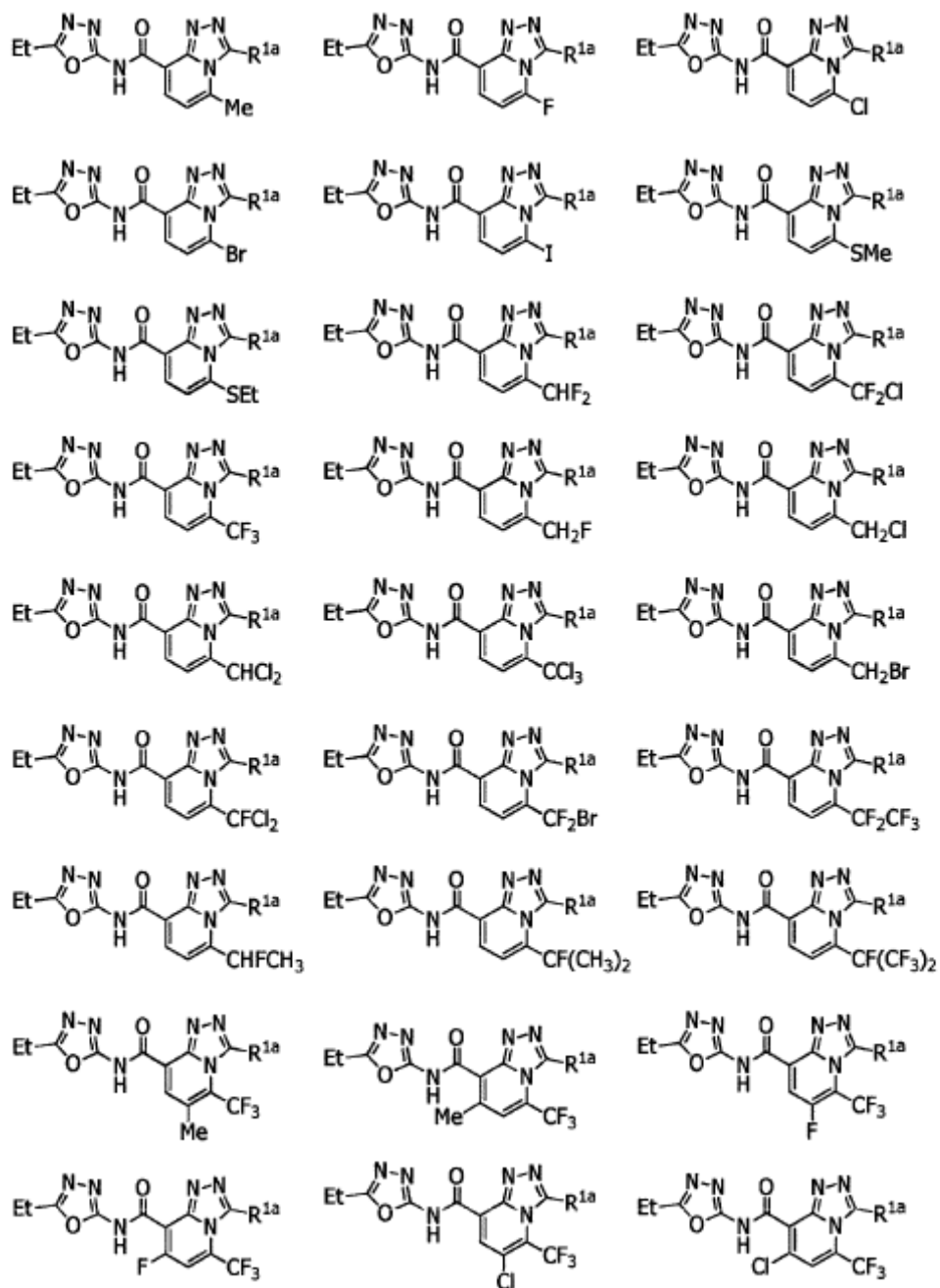
Primera tabla

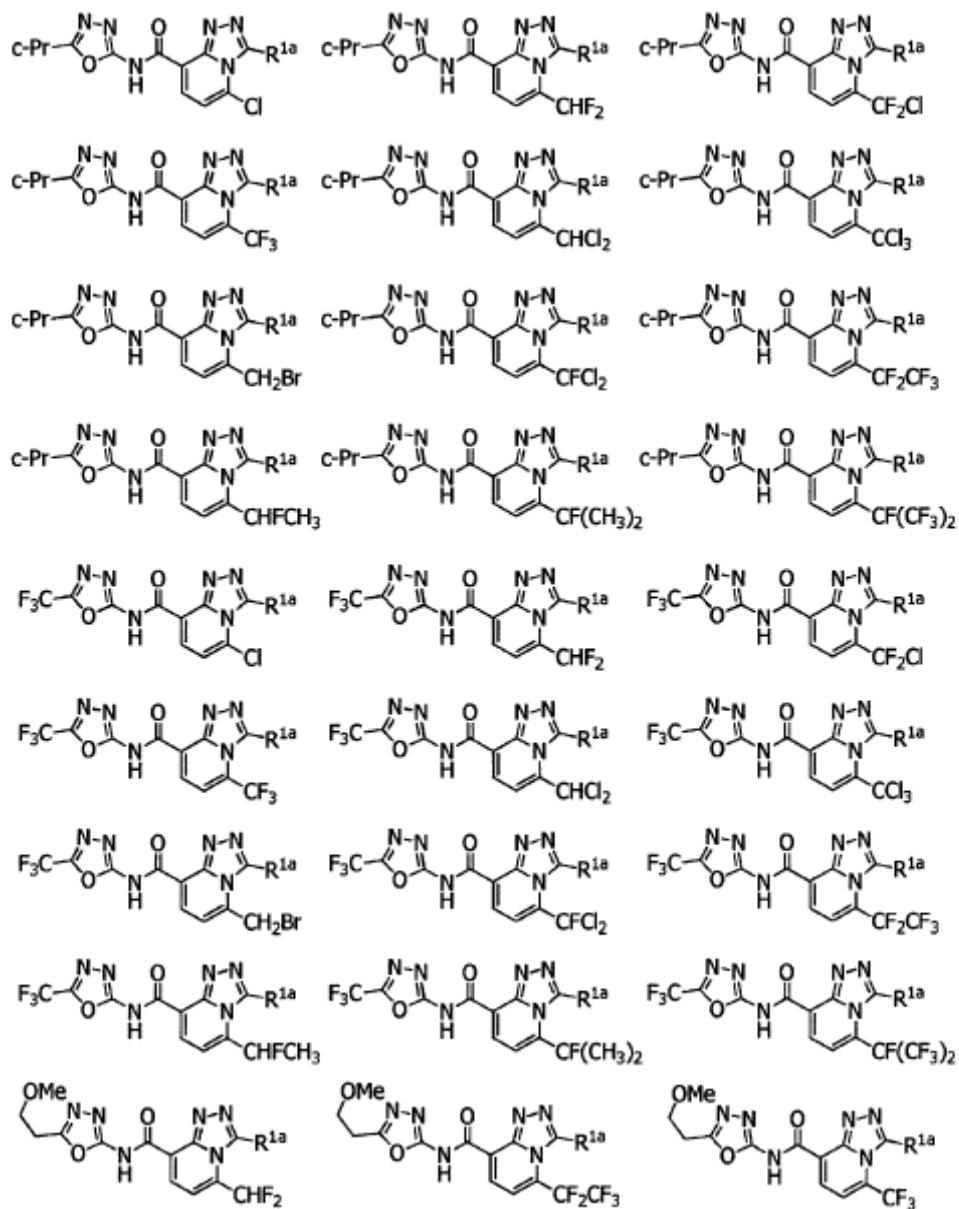


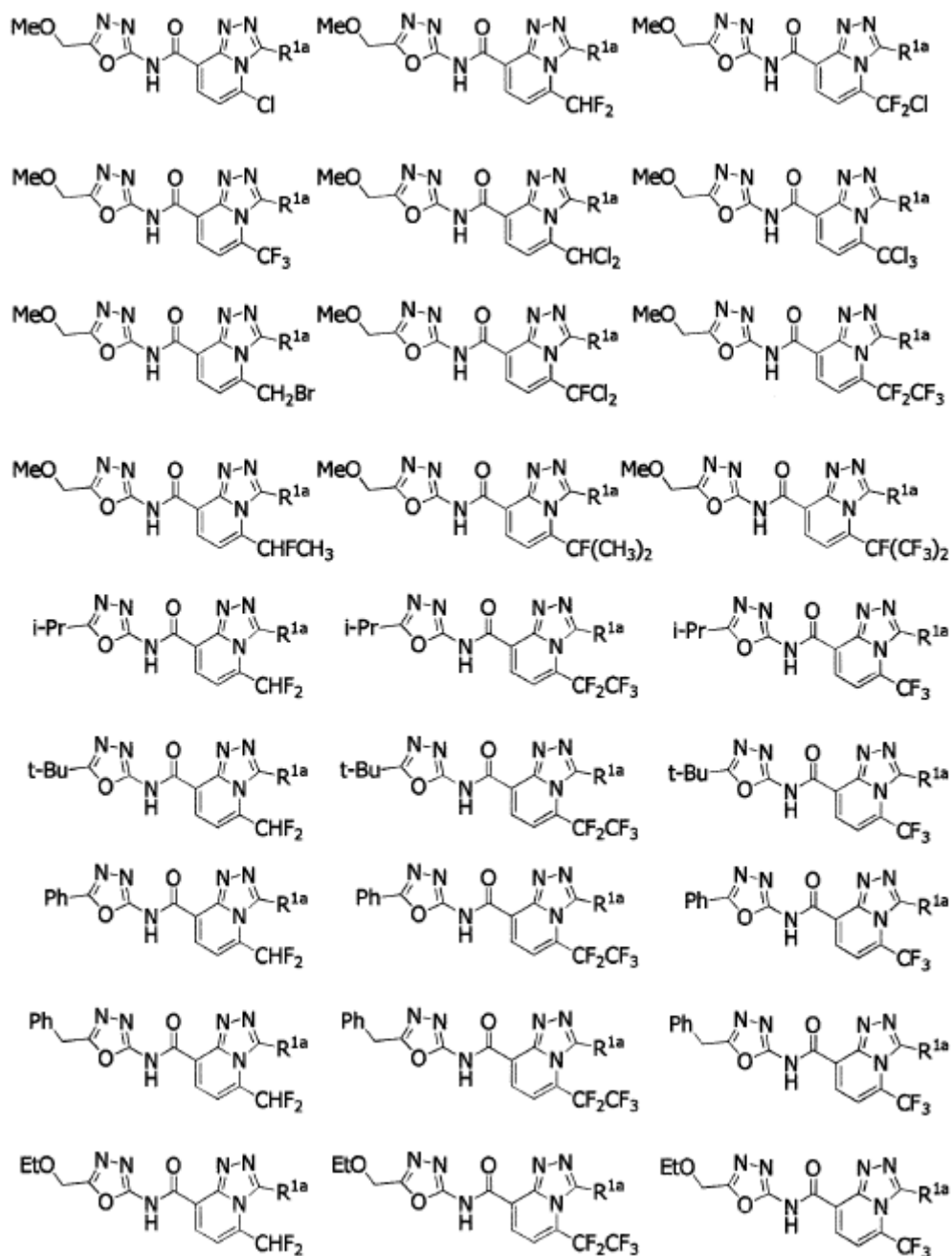


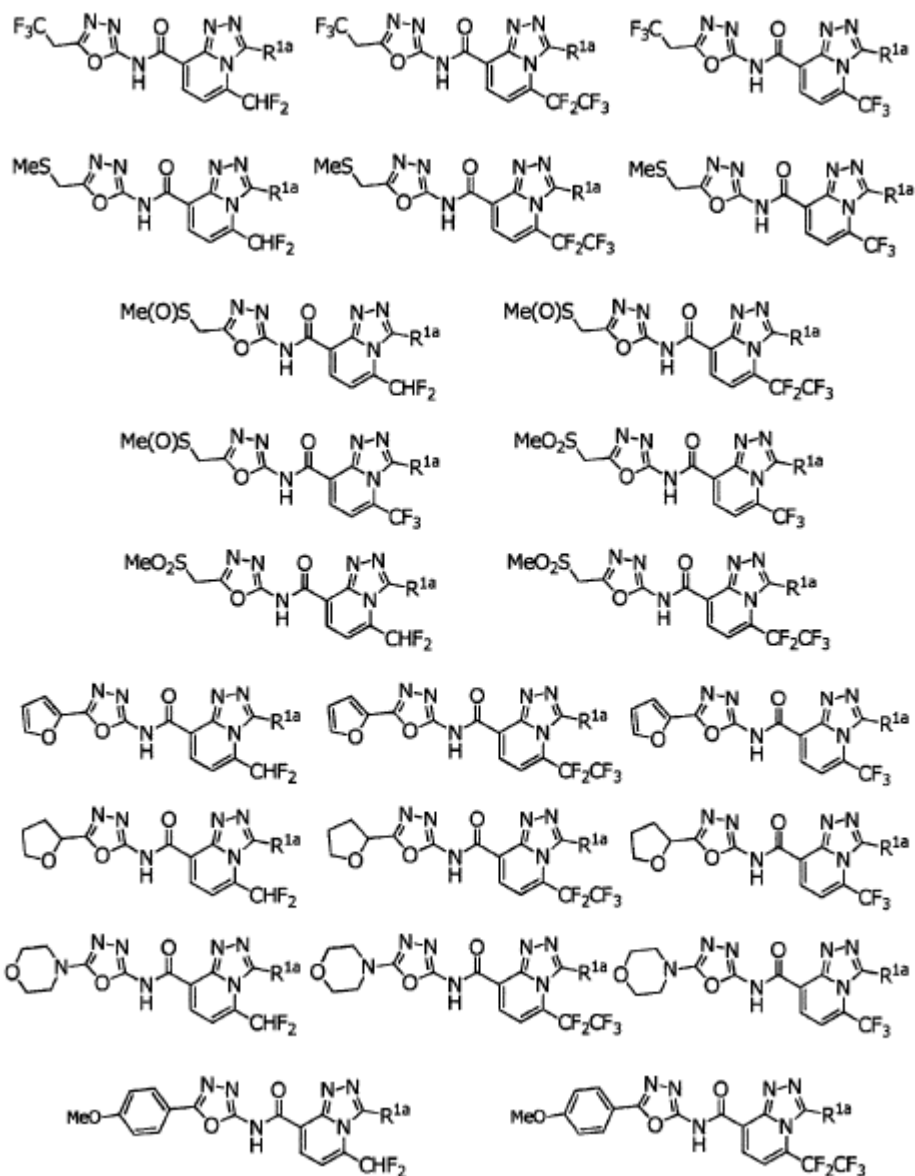


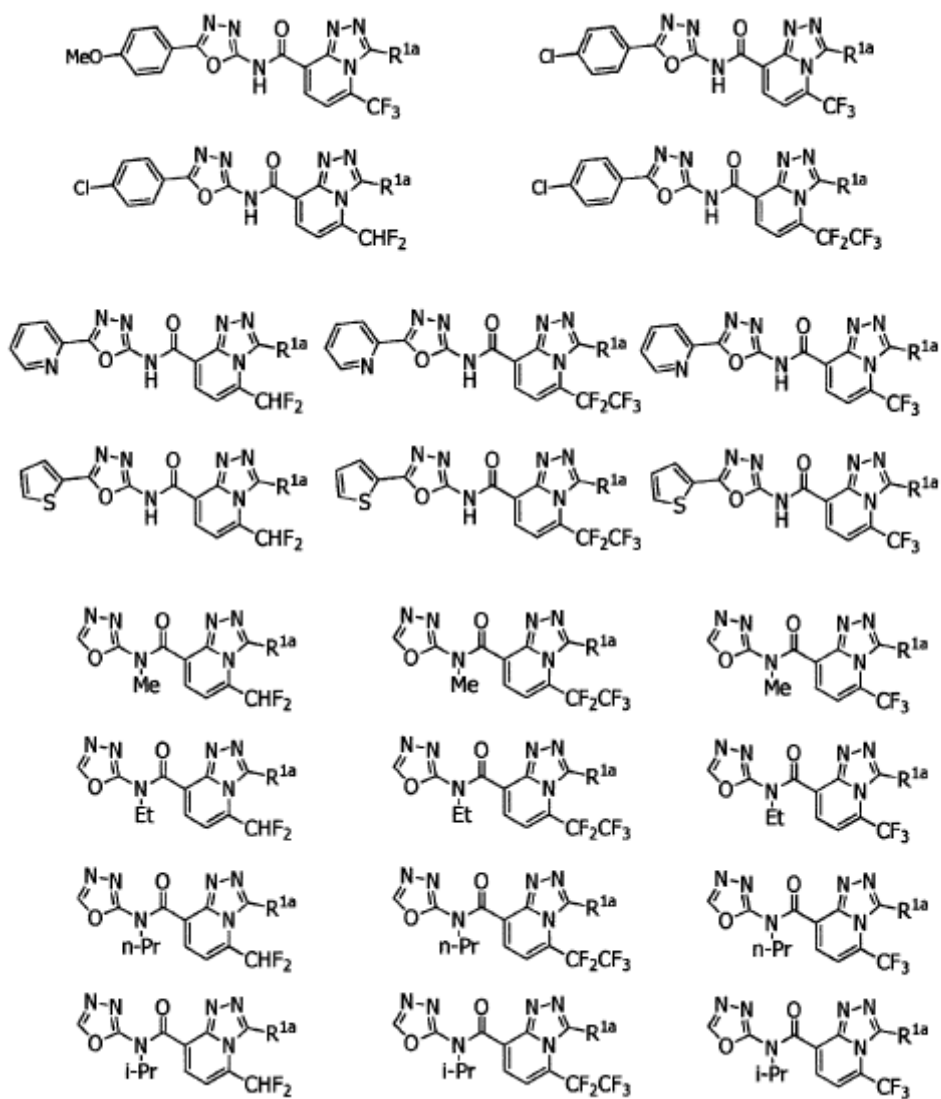


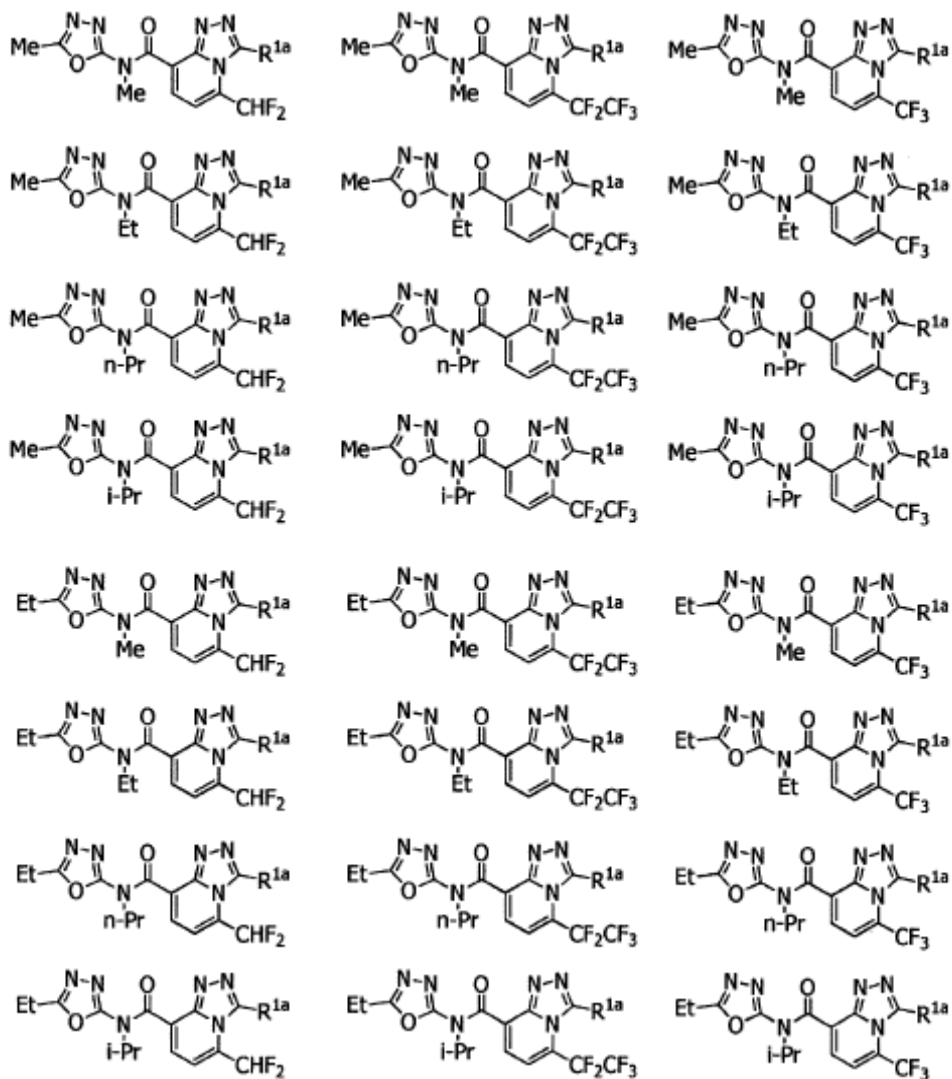


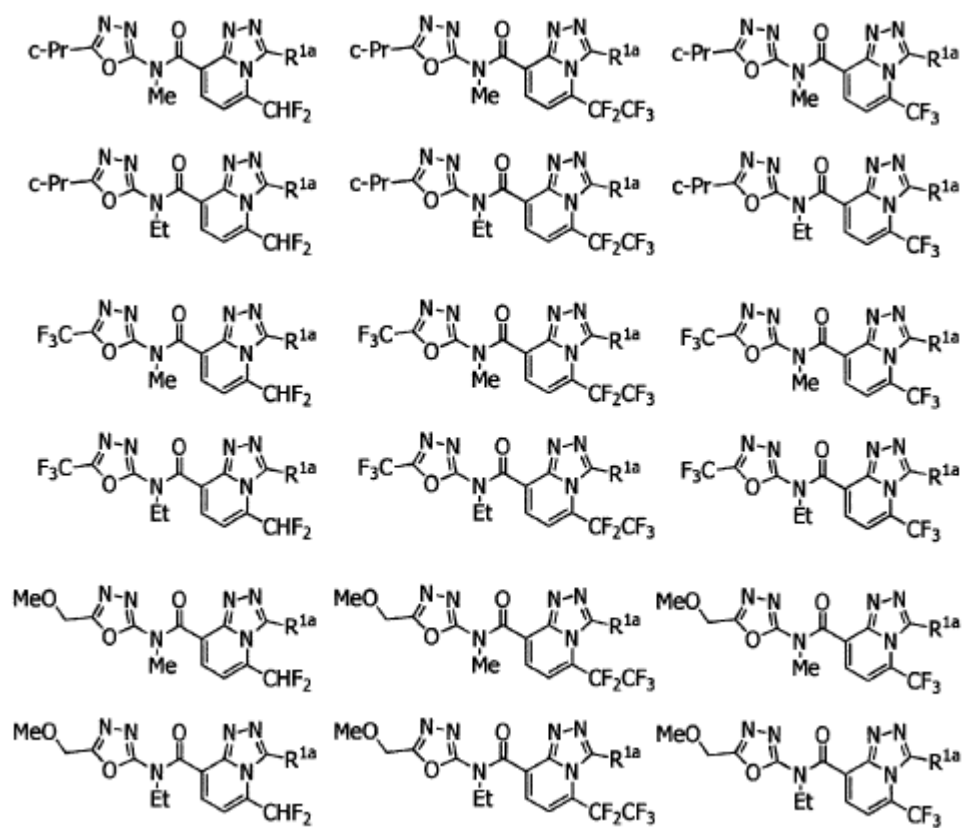


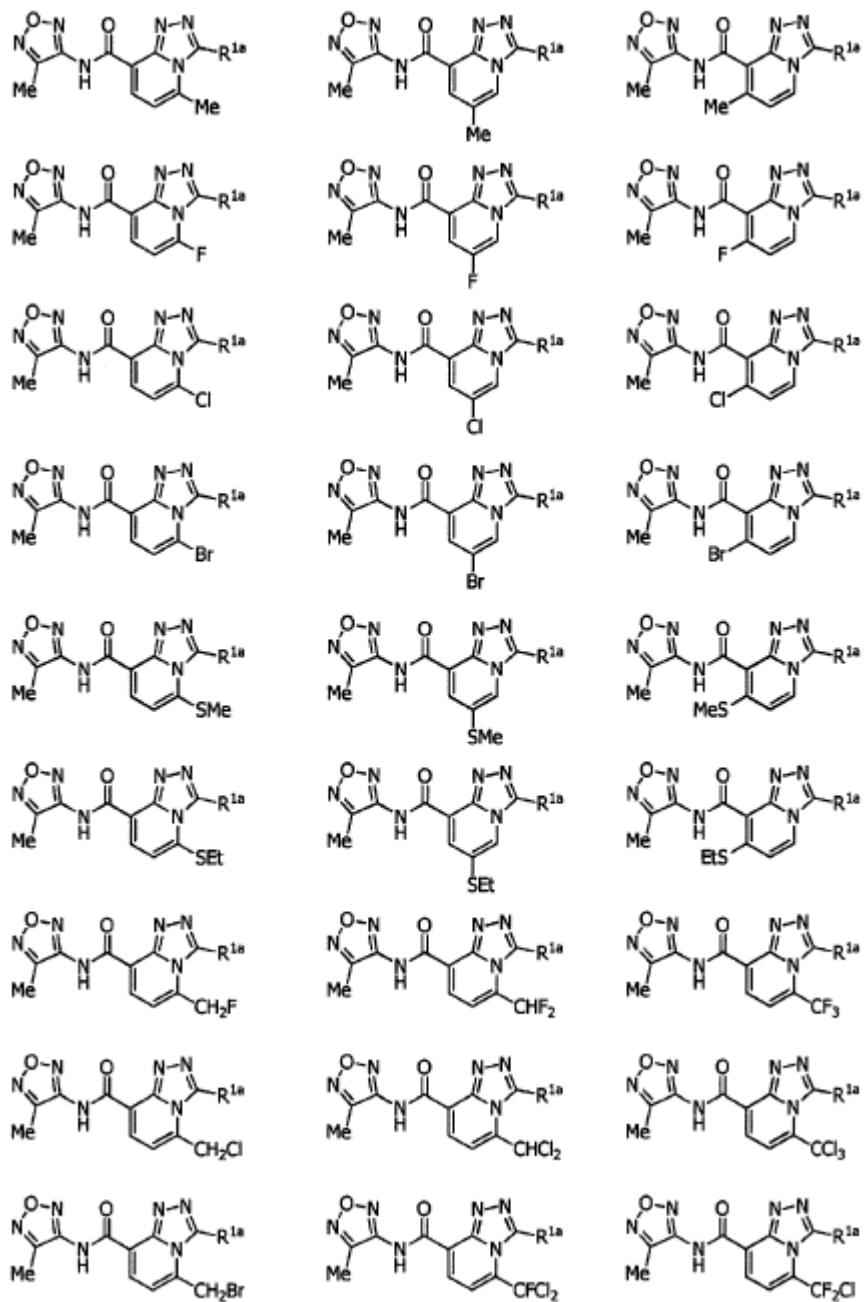


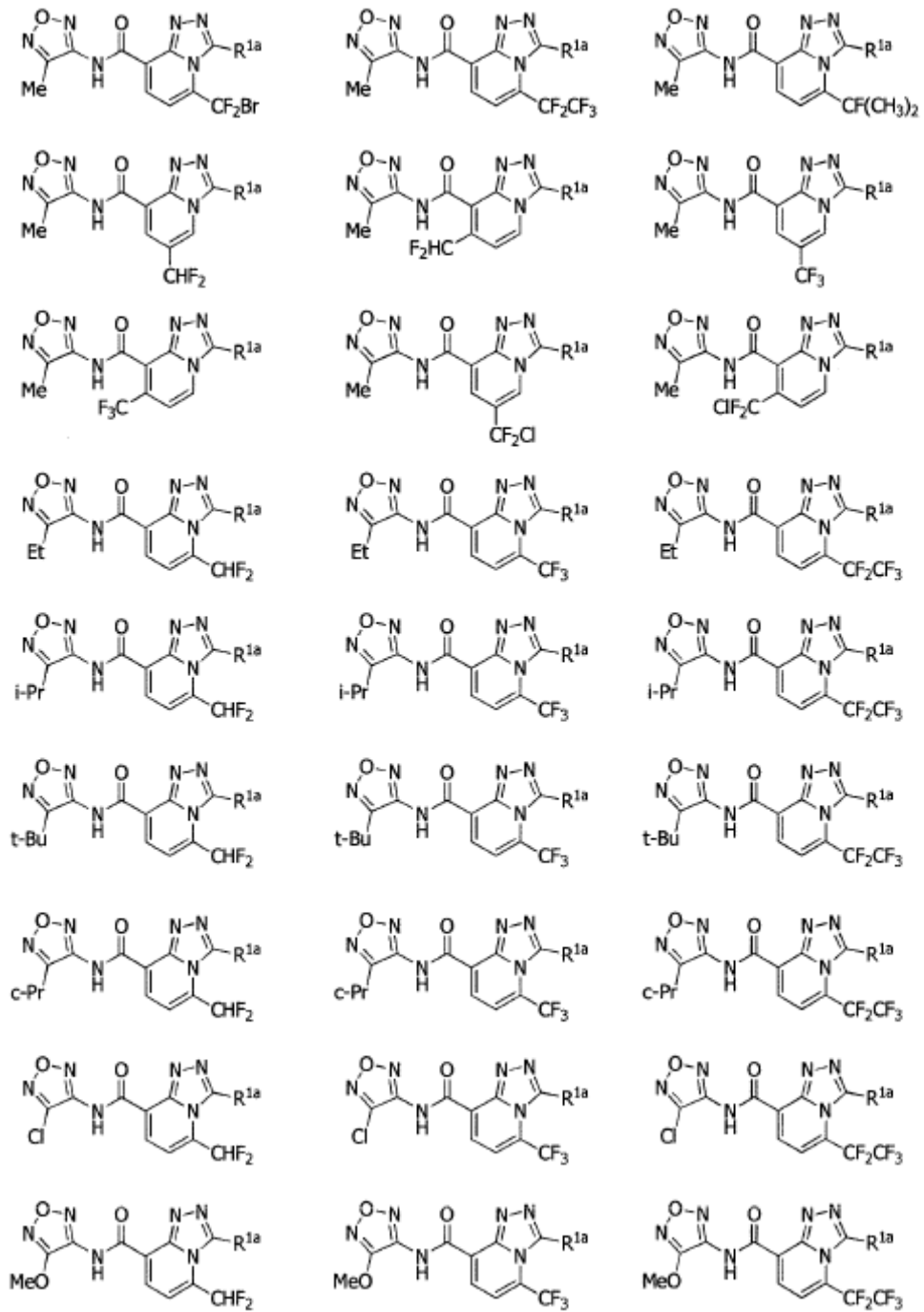


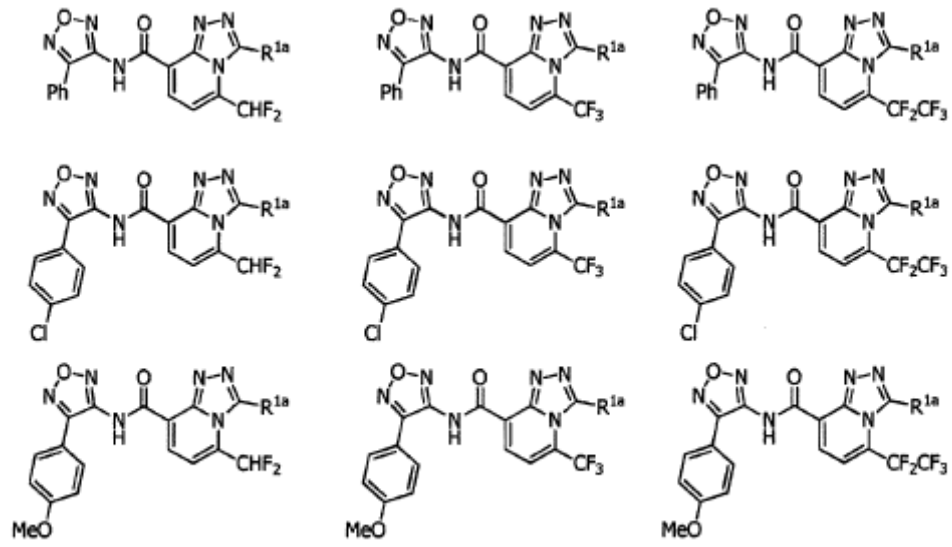


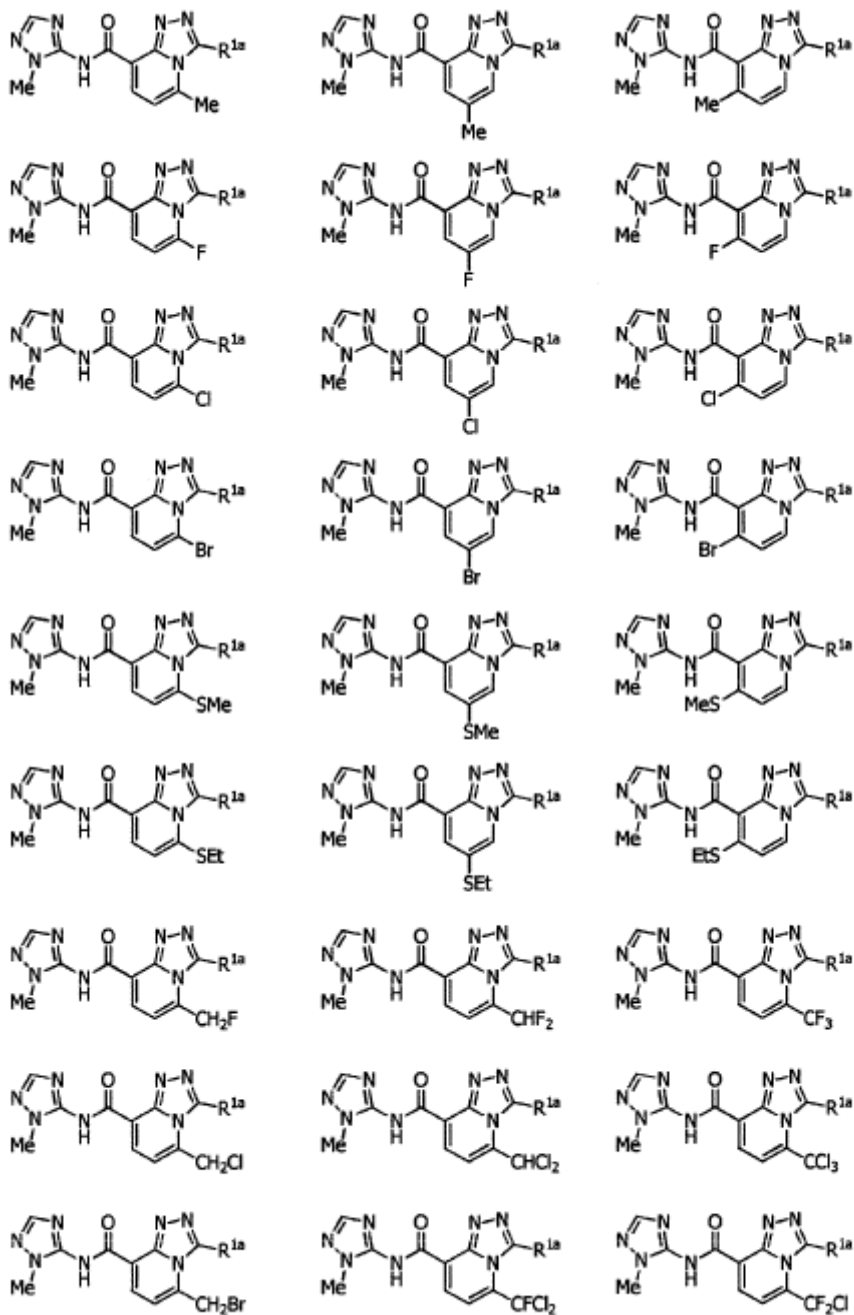


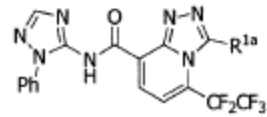
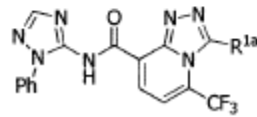
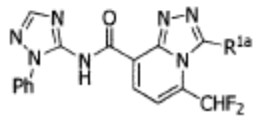
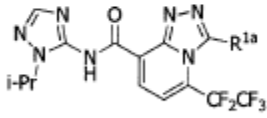
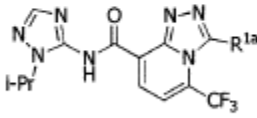
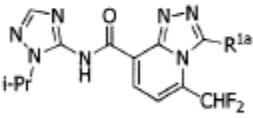
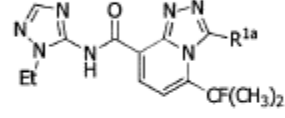
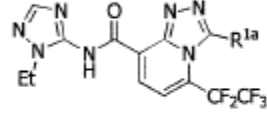
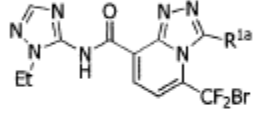
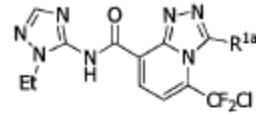
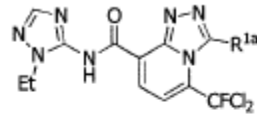
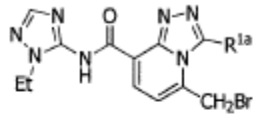
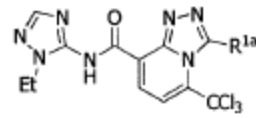
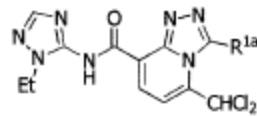
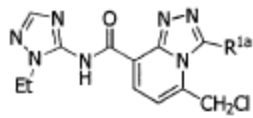
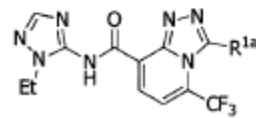
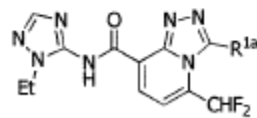
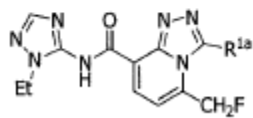
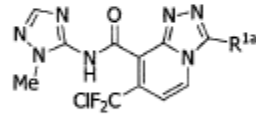
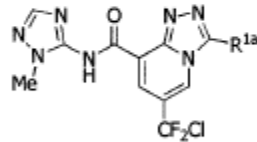
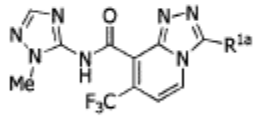
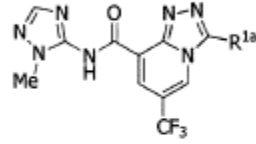
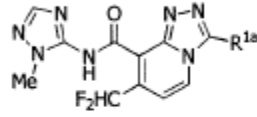
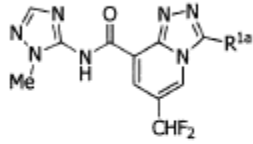
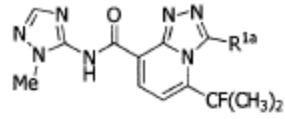
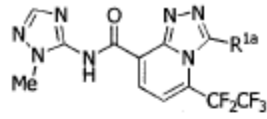
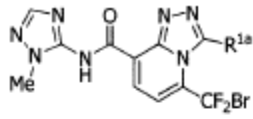












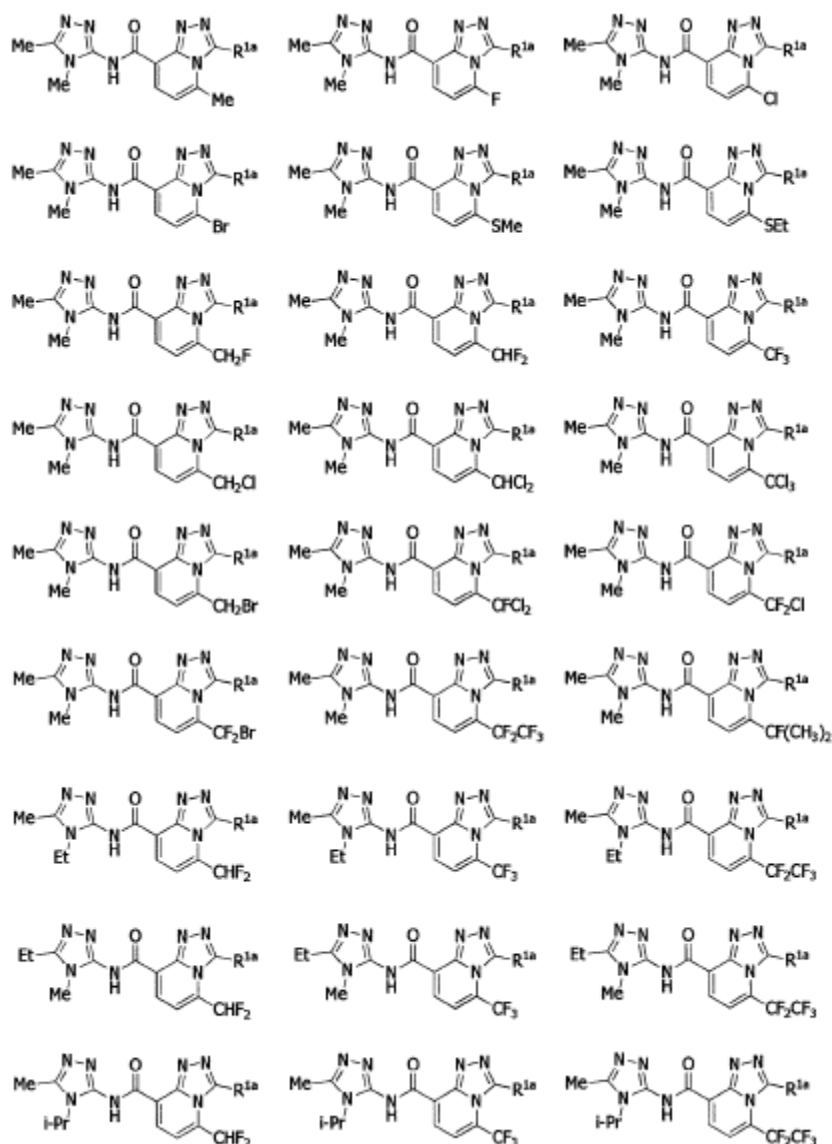


Tabla 1

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
H	CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ CH ₂ CN
F	(CH ₂) ₃ Cl	CH ₂ Pr-c
Cl	(CH ₂) ₃ Br	CH ₂ (D-16)
Br	(CH ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ (D-16d)
I	CHFCH ₃	CH ₂ Bu-c
Me	CF ₂ CH ₃	CH ₂ Pen-c
Et	CF(CH ₃) ₂	CH ₂ Hex-c
Pr-n	CF ₂ CF ₂ H	CH(Me)Pr-c
Pr-i	CF ₂ CF ₃	CH(Me)(D-16)
Pr-c	CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)(D-16e)
Bu-n	CF(CF ₃)	CH(Me)Bu-c
Bu-i	CH(Me)Cl	CH(Me)Pen-c
Bu-c	CH(Me)Br	CH(Me)Hex-c
Bu-s	CH(Et)Cl	(CH ₂) ₂ Pr-c
Bu-t	CH(Et)Br	(CH ₂) ₂ (D-16)
Pen-n	CH(Pr-n)Cl	(CH ₂) ₂ (D-16e)
Pen-i	CH(Pr-n)Br	(CH ₂) ₂ Bu-c
Pen-c	CH(Pr-i)Cl	(CH ₂) ₂ Pen-c
Pen-s	CH(Pr-i)Br	(CH ₂) ₂ Hex-c

Pen-t	C(Me) ₂ Cl	CH ₂ OMe
3-Pen	C(Me) ₂ Br	CH ₂ OEt
Hex-n	CH(Me)CH ₂ Cl	CH ₂ OPr-n
Hex-c	CH(Me)CH ₂ Br	CH ₂ OPr-i
CH ₂ Cl	C(Me) ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ OBu-n
CH ₂ Br	C(Me) ₂ CH ₂ Br	CH ₂ OBu-i
CHBr ₂	CH ₂ CN	CH ₂ OBu-s
CF ₂ H	(CH ₂) ₂ CN	CH ₂ OBu-t
CF ₂ Cl	(CH ₂) ₃ CN	CH ₂ OPen-n
CF ₂ Br	CH(Me)CN	CH ₂ OPen-i
CF ₃	CH(Et)CN	CH ₂ OPen-s
(CH ₂) ₂ Cl	CH(Pr-n)CN	CH ₂ OPen-t
(CH ₂) ₂ Br	CH(Pr-i)CN	CH ₂ OHex-n
CH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ CN	CH(Me)OMe
CH ₂ CF ₂ Cl	CH(Me)CH ₂ CN	CH(Me)OEt
CH ₂ CF ₂ Br	CH(Et)CH ₂ CN	CH(Me)OPr-n

Tabla 2

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Me)OPr-i	C(Me) ₂ OBu-n	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Me)OBu-n	C(Me) ₂ OBu-i	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Br
CH(Me)OBu-i	C(Me) ₂ OBu-s	CH(Me)OCF ₂ H
CH(Me)OBu-s	C(Me) ₂ OBu-t	CH(Me)OCF ₃
CH(Me)OBu-t	(CH ₂) ₂ OMe	CH(Me)OCH ₂ CF ₂ H
CH(Me)OPen-n	(CH ₂) ₂ OEt	CH(Me)OCH ₂ CF ₃
CH(Me)OPen-i	(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Me)O(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Me)OPen-s	(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Me)O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Me)OPen-t	(CH ₂) ₂ OBu-n	CH(Me)O(CH ₂) ₂ Br
CH(Me)OHex-n	(CH ₂) ₂ OBu-i	CH(Et)OCF ₂ H
CH(Et)OMe	(CH ₂) ₂ OBu-s	CH(Et)OCF ₃
CH(Et)OEt	(CH ₂) ₂ OBu-t	CH(Et)OCH ₂ CF ₂ H
CH(Et)OPr-n	CH(Me)CH ₂ OMe	CH(Et)OCH ₂ CF ₃
CH(Et)OPr-i	CH(Me)CH ₂ OEt	CH(Et)O(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)OBu-n	CH(Me)CH ₂ OPr-n	CH(Et)O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)OBu-i	CH(Me)CH ₂ OPr-i	CH(Et)O(CH ₂) ₂ Br
CH(Et)OBu-s	CH(Me)CH ₂ OBu-n	C(Me) ₂ OCF ₂ H
CH(Et)OBu-t	CH(Me)CH ₂ OBu-i	C(Me) ₂ OCF ₃
CH(Et)OPen-n	CH(Me)CH ₂ OBu-s	C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₂ H
CH(Et)OPen-i	CH(Me)CH ₂ OBu-t	C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₃
CH(Et)OPen-s	CH(Et)CH ₂ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)OPen-t	CH(Et)CH ₂ OEt	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)OHex-n	(CH ₂) ₃ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)OMe	(CH ₂) ₃ OEt	(CH ₂) ₂ OCF ₃
CH(Pr-n)OEt	(CH ₂) ₃ OPr-n	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)OPr-n	(CH ₂) ₃ OPr-i	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃
CH(Pr-n)OPr-i	(CH ₂) ₃ OBu-n	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)OMe	(CH ₂) ₃ OBu-i	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)OEt	(CH ₂) ₃ OBu-s	CH ₂ OH
CH(Pr-i)OPr-n	(CH ₂) ₃ OBu-t	CH(Me)OH
CH(Pr-i)OPr-i	CH ₂ OCF ₂ H	CH(Et)OH
C(Me) ₂ OMe	CH ₂ OCF ₃	CH(iPr)OH
C(Me) ₂ OEt	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ OH
C(Me) ₂ OPr-n	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ OH
C(Me) ₂ OPr-i	CH ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)CH ₂ OH

5 Tabla 3

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
(CH ₂) ₃ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Me)OC(O)Pr-i
CH ₂ OCH ₂ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Et)OC(O)Me
CH ₂ OCH ₂ OEt	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe	CH(Et)OC(O)Et
CH ₂ OCH ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OEt	CH(Et)OC(O)Pr-i
CH ₂ OCH ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-n	CH ₂ OPh
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-i	CH(Me)OPh

CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OH
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OMe
CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH ₂ C(O)OEt
CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OMe	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ C(O)OPr-n
CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OMe	CH ₂ C(O)OPr-i
CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ C(O)OBu-n
CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OBu-i
CH ₂ OCH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OBu-s
CH ₂ OCH(Me)OEt	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OMe	CH ₂ C(O)OBu-t
CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ C(O)OPen-n
CH ₂ O(CH ₂) ₃ OEt	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OPen-i
CH(Me)OCH ₂ OMe	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OPen-s
CH(Me)OCH ₂ OEt	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)OPen-t
CH(Me)OCH ₂ OPr-n	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)OHex-n
CH(Me)OCH ₂ OPr-i	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH ₂ C(O)OCH ₂ OMe
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OMe	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OEt	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH ₂ C(O)NHMe
CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OMe	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ C(O)NHEt
CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ C(O)NHPr-n
CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ C(O)NHPr-i
CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Me)C(O)OH
C(Me) ₂ OCH ₂ OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Me)C(O)OMe
C(Me) ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ OC(O)Me	CH(Me)C(O)OEt
C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-n	CH ₂ OC(O)Et	CH(Me)C(O)OPr-i
C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-i	CH ₂ OC(O)Pr-i	CH(Me)C(O)OCH ₂ OMe
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CH(Me)OC(O)Me	CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	CH(Me)OC(O)Et	CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt

Tabla 4

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SPr-i
CH(Me)C(O)NHMe	CH ₂ SBu-n	CH(Me)S(O)Pr-i
CH(Me)C(O)NHEt	CH ₂ S(O)Bu-n	CH(Me)S(O) ₂ Pr-i
CH(Me)C(O)NHPr-n	CH ₂ S(O) ₂ Bu-n	CH(Me)SBu-n
CH(Me)C(O)NHPr-i	CH ₂ SBu-i	CH(Me)S(O)Bu-n
CH(Et)C(O)OH	CH ₂ S(O)Bu-i	CH(Me)S(O) ₂ Bu-n
CH(Et)C(O)OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-i	CH(Me)SBu-i
CH(Et)C(O)OEt	CH ₂ SBu-s	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Et)C(O)OPr-i	CH ₂ S(O)Bu-s	CH(Me)S(O) ₂ Bu-i
CH(Et)C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-s	CH(Me)SBu-s
CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ SBu-t	CH(Me)S(O)Bu-s
CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O)Bu-t	CH(Me)S(O) ₂ Bu-s
CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Bu-t	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)NHMe	CH ₂ SPen-n	CH(Me)S(O)Bu-t
CH(Et)C(O)NHEt	CH ₂ S(O)pen-n	CH(Me)S(O) ₂ Bu-t
(CH ₂) ₂ C(O)OH	CH ₂ S(O) ₂ Pen-n	CH(Me)SPen-n
(CH ₂) ₂ C(O)OMe	CH ₂ SPen-i	CH(Me)S(O)Pen-n
(CH ₂) ₂ C(O)OEt	CH ₂ S(O)pen-i	CH(Me)S(O) ₂ Pen-n
(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Pen-i	CH(Me)SPen-i
(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ SPen-s	CH(Me)S(O)pen-i
(CH ₂) ₂ C(O)NHMe	CH ₂ S(O)pen-s	CH(Me)S(O) ₂ Pen-i
(CH ₂) ₂ C(O)NHEt	CH ₂ S(O) ₂ Pen-s	CH(Me)SPen-s
(CH ₂) ₂ C(O)NHPr-n	CH ₂ SPen-t	CH(Me)S(O)Pen-s
(CH ₂) ₂ C(O)NHPr-i	CH ₂ S(O)pen-t	CH(Me)S(O) ₂ Pen-s
CH ₂ SMe	CH ₂ S(O) ₂ Pen-t	CH(Me)SPen-t
CH ₂ S(O)Me	CH ₂ SHex-n	CH(Me)S(O)Pen-t
CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Me)SMe	CH(Me)S(O) ₂ Pen-t
CH ₂ SEt	CH(Me)S(O)Me	CH(Me)SHex-n
CH ₂ S(O)Et	CH(Me)S(O) ₂ Me	C(Me) ₂ SMe
CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Me)SEt	C(Me) ₂ S(O)Me
CH ₂ SPr-n	CH(Me)S(O)Et	C(Me) ₂ S(O) ₂ Me
CH ₂ S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ Et	C(Me) ₂ SEt
CH ₂ S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SPr-n	C(Me) ₂ S(O)Et

CH ₂ SPr-i	CH(Me)S(O)Pr-n	C(Me) ₂ S(O) ₂ Et
CH ₂ S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ Pr-n	C(Me) ₂ SPr-n

Tabla 5

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
C(Me) ₂ S(O)Pr-n	(CH ₂) ₂ SPr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-n	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-n
C(Me) ₂ SPr-i	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)Pr-i	(CH ₂) ₂ SPr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-i	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-i
C(Me) ₂ SBU-n	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-i
C(Me) ₂ S(O)BU-n	(CH ₂) ₃ SMe	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-i
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-n	(CH ₂) ₃ (O)Me	CH(Et)SMe
C(Me) ₂ SBU-i	(CH ₂) ₃ (O) ₂ Me	CH(Et)S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)BU-i	(CH ₂) ₃ SEt	CH(Et)S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-i	(CH ₂) ₃ S(O)Et	CH(Et)SEt
C(Me) ₂ SBU-s	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Et	CH(Et)S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)BU-s	CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Et)S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-s	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Et)SPr-n
C(Me) ₂ SBU-t	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Et)S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)BU-t	CH(Me)CH ₂ SEt	CH(Et)S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ BU-t	CH(Me)CH ₂ S(O)Et	CH(Et)SPr-i
C(Me) ₂ SPen-n	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Et)S(O)Pr-i
C(Me) ₂ S(O)Pen-n	CH(Me)CH ₂ SPr-n	CH(Et)S(O) ₂ Pr-i
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-n	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-n	CH(Pr-n)SMe
C(Me) ₂ SPen-i	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-n	CH(Pr-n)S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)Pen-i	CH(Me)CH ₂ SPr-i	CH(Pr-n)S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-i	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-i	CH(Pr-n)SEt
C(Me) ₂ SPen-s	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-i	CH(Pr-n)S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Pen-s	CH(Et)CH ₂ SMe	CH(Pr-n)S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-s	CH(Et)CH ₂ S(O)Me	CH(Pr-n)SPr-n
C(Me) ₂ SPen-t	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Pr-n)S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)Pen-t	CH(Et)CH ₂ SEt	CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-t	CH(Et)CH ₂ S(O)Et	CH(Pr-n)SPr-i
(CH ₂) ₂ SMe	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Pr-n)S(O)Pr-i
(CH ₂) ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-i
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Pr-i)SMe
(CH ₂) ₂ SEt	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Pr-i)S(O)Me
(CH ₂) ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ CH ₂ SEt	CH(Pr-i)S(O) ₂ Me
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Pr-i)SEt

5 Tabla 6

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Pr-i)S(O)Et	CH ₂ SCF(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O) ₂ Et	CH(Me)SCF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)SPr-n	CH(Me)S(O)CF ₂ H	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SCF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)SPr-i	CH(Me)S(O)CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH ₂ SCF ₂ H	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ SCF ₃
CH ₂ S(O)CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ S(O)CF ₃
CH ₂ S(O) ₂ CF ₂ H	CH(Me)SCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CF ₃
CH ₂ SCF ₃	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O)CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O) ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H
CH ₂ SCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃
CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃
CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl
CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Br	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl

CH ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Br	(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Br
CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ SCF ₂ H	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH ₂ S(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O)CF ₂ H	CH=CH ₂
CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₂ H	CH=CHMe
CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ SCF ₃	CH=CMe ₂
CH ₂ S(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CHMe
CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₂ H	CH ₂ C(Me)=CH ₂
CH ₂ SCHFCH ₃	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
CH ₂ SCF ₂ CH ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	C(Me)=CH ₂
CH ₂ SCF(CH ₃) ₂	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₃	C(Me)=CHMe
CH ₂ SCF ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	C(Me)=CMe ₂
CH ₂ SCF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)CH=CH ₂
CH ₂ SCF ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃	C(Et)=CH ₂

Tabla 7

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
C(Et)=CHMe	2,4-(Cl) ₂ -Ph	3-F-4-Cl-Ph
C(Et)=CMe ₂	2,5-(Cl) ₂ -Ph	3-F-5-Cl-Ph
CH(Et)CH=CH ₂	2,6-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-3-F-Ph
C≡CH	3,4-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-4-F-Ph
C≡CMe	3,5-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-5-F-Ph
CH ₂ C≡CH	2,3-(Me) ₂ -Ph	3-Me-4-F-Ph
CH ₂ C≡CMe	2,4-(Me) ₂ -Ph	3-Me-5-F-Ph
CH(Me)C≡CH	2,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,6-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
Ph	3,4-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	3,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
3-F-Ph	2,3-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
4-F-Ph	2,4-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	2,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-Cl-Ph	2,6-(MeO) ₂ -Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-Cl-Ph	3,4-(MeO) ₂ -Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Br-Ph	3,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-6-MeO-Ph
3-Br-Ph	2-Cl-3-Me-Ph	3-F-4-MeO-Ph
4-Br-Ph	2-Cl-4-Me-Ph	3-F-5-MeO-Ph
2-Me-Ph	2-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-3-F-Ph
3-Me-Ph	3-Cl-4-Me-Ph	2-MeO-4-F-Ph
4-Me-Ph	3-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-5-F-Ph
2-CF ₃ -Ph	2-Cl-3-F-Ph	2-MeO-6-F-Ph
3-CF ₃ -Ph	2-Cl-4-F-Ph	3-MeO-4-F-Ph
4-CF ₃ -Ph	2-Cl-5-F-Ph	3-MeO-5-F-Ph
2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph	2-MeO-3-Cl-Ph
3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph	2-MeO-4-Cl-Ph
4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph	2-MeO-5-Cl-Ph
2,3-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Me-Ph	2-MeO-6-Cl-Ph
2,4-(F) ₂ -Ph	2-F-5-Me-Ph	3-MeO-4-Cl-Ph
2,5-(F) ₂ -Ph	3-F-4-Me-Ph	3-MeO-5-Cl-Ph
2,6-(F) ₂ -Ph	3-F-5-Me-Ph	2-Me-3-MeO-Ph
3,4-(F) ₂ -Ph	2-F-3-Cl-Ph	2-Me-4-MeO-Ph
3,5-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Me-5-MeO-Ph
2,3-(Cl) ₂ -Ph	2-F-5-Cl-Ph	2-Me-6-MeO-Ph

5 Tabla 8

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
3-Me-4-MeO-Ph	D-11	CH ₂ (2,5-(MeO) ₂ -Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-12	CH ₂ (2,6-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-13a	CH ₂ (3,4-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-4-Me-Ph	D-14	CH ₂ (3,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-5-Me-Ph	D-16	CH(Me)(2-MeO-Ph)
2-MeO-6-Me-Ph	D-16a	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-4-Me-Ph	D-16b	CH(Me)(4-MeO-Ph)

3-MeO-5-Me-Ph	D-16c	CH(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
3,5-(F) ₂ -4-Me-Ph	D-16d	CH(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
3,5-(F) ₂ -4-MeO-Ph	D-16e	CH(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
3,4,5-(MeO) ₃ -Ph	D-16f	CH(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
D-3	D-16g	CH(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
D-3a	D-16h	CH(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
D-4	D-16i	CH(Et)(2-MeO-Ph)
D-4a	D-16j	CH(Et)(3-MeO-Ph)
D-4b	D-16k	CH(Et)(4-MeO-Ph)
D-8	D-16m	(CH ₂) ₂ (2-MeO-Ph)
D-8a	D-16n	(CH ₂) ₂ (3-MeO-Ph)
D-8b	D-16p	(CH ₂) ₂ (4-MeO-Ph)
D-8c	D-17	CHO
D-8d	D-17a	CH=NOMe
D-8e	D-17b	OMe
D-8f	D-19	OEt
D-8g	D-24a	OPr-n
D-8h	D-24b	OPr-i
D-9	D-24c	OBu-n
D-9a	D-24d	OBu-i
D-9c	D-24e	OBu-s
D-9d	D-24f	OBu-t
D-9f	CH ₂ Ph	OPen-n
D-9g	CH ₂ (2-MeO-Ph)	OPen-i
D-9i	CH ₂ (3-MeO-Ph)	OPen-s
D-9j	CH ₂ (4-MeO-Ph)	OPen-t
D-9m	CH ₂ (2,3-(MeO) ₂ -Ph)	OHex-n
D-10a	CH ₂ (2,4-(MeO) ₂ -Ph)	SMe

Tabla 9

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O)Me	SPen-n	S(CH ₂) ₂ Cl
S(O) ₂ Me	S(O)Pen-n	S(O)(CH ₂) ₂ Cl
SEt	S(O) ₂ Pen-n	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
S(O)Et	SPen-i	SCH(Me)CH ₂ Cl
S(O) ₂ Et	S(O)Pen-i	SCH ₂ CH(Me)Cl
SPr-n	S(O) ₂ Pen-i	S(CH ₂) ₃ Cl
S(O)Pr-n	SPen-c	SCF ₃
S(O) ₂ Pr-n	S(O)Pen-c	SCH ₂ CF ₃
SPr-i	S(O) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ CF ₃
S(O)Pr-i	SPen-s	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃
S(O) ₂ Pr-i	S(O)Pen-s	SCH(Me)CF ₃
SPr-c	S(O) ₂ Pen-s	S(CH ₂) ₂ CF ₃
S(O)Pr-c	SPen-t	S(CH ₂) ₃ CF ₃
S(O) ₂ Pr-c	S(O)Pen-t	SCHFCH ₃
S(D-16)	S(O) ₂ Pen-t	SCF ₂ CH ₃
S(O)(D-16)	SHex-n	SCF(CH ₃) ₂
S(O) ₂ (D-16)	SHex-c	SCF ₂ CF ₂ H
S(D-16e)	SCH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₃
S(O)(D-16e)	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₂ CF ₃
S(O) ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ CH=CH ₂	SCF(CF ₃)
SBU-n	SCH(Me)CH=CH ₂	SCH ₂ OMe
S(O)Bu-n	SC(Me) ₂ CH=CH ₂	S(CH ₂) ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-n	SCH ₂ CH=CHMe	S(O)(CH ₂) ₂ OMe
SBU-i	SCH ₂ C(Me)=CH ₂	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OMe
S(O)Bu-i	S(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂	SCH(Me)CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-i	SC(Me)=CH ₂	S(O)CH(Me)CH ₂ OMe
SBU-c	SC(Me)=CH(Me)	S(O) ₂ CH(Me)CH ₂ OMe
S(O)Bu-c	SCH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH(Me)OMe
S(O) ₂ Bu-c	S(O)CH ₂ C≡CH	S(O)CH ₂ CH(Me)OMe
SBU-s	S(O) ₂ CH ₂ C≡CH	S(O) ₂ CH ₂ CH(Me)OMe
S(O)Bu-s	SCH(Me)C≡CH	SC(Me) ₂ CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-s	SC(Me) ₂ C≡CH	S(CH ₂) ₃ OMe
SBU-t	SCH ₂ C≡CMe	SCH ₂ OEt
S(O)Bu-t	SCH ₂ Cl	S(CH ₂) ₂ OEt

S(O) ₂ Bu-t	SCH(Me)Cl	S(O)(CH ₂) ₂ OEt
------------------------	-----------	---

Tabla 10

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OEt	S(O) ₂ CH ₂ CN	SCH(Me)C(O)Me
SCH(Me)CH ₂ OEt	SCH(Me)CN	S(CH ₂) ₂ C(O)Me
SCH ₂ OPr-i	S(O)CH(Me)CN	SCH ₂ C(O)OMe
S(CH ₂) ₂ OPr-i	S(O) ₂ CH(Me)CN	SCH(Me)C(O)OMe
S(O)(CH ₂) ₂ OPr-i	SC(Me) ₂ CN	S(CH ₂) ₂ C(O)OMe
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OPr-i	S(O)C(Me) ₂ CN	SCH ₂ C(O)OEt
SCH(Me)CH ₂ OPr-i	S(O) ₂ C(Me) ₂ CN	SCH(Me)C(O)OEt
SCH ₂ Pr-c	S(CH ₂) ₂ CN	S(CH ₂) ₂ C(O)OEt
S(O)CH ₂ Pr-c	S(O)(CH ₂) ₂ CN	SCH ₂ (D-8a)
S(O) ₂ CH ₂ Pr-c	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8a)
SCH(Me)Pr-c	SCH ₂ Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8a)
S(O)CH(Me)Pr-c	S(O)CH ₂ Ph	SCH ₂ (D-8b)
S(O) ₂ CH(Me)Pr-c	S(O) ₂ CH ₂ Ph	S(O)CH ₂ (D-8b)
S(CH ₂) ₂ Pr-c	SCH(Me)Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8b)
SCH ₂ (D-16)	S(O)CH(Me)Ph	SCH ₂ (D-8c)
S(O)CH ₂ (D-16)	S(O) ₂ CH(Me)Ph	S(O)CH ₂ (D-8c)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16)	SCH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8c)
SCH ₂ (D-16e)	S(O)OH ₂ (2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8d)
S(O)CH ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O)CH ₂ (D-8d)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8d)
SCH ₂ Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8e)
S(O)CH ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8)
S(O) ₂ CH ₂ Bu-c	SCH ₂ (3-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8f)
SCH(Me)Bu-c	S(O)CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8f)
S(CH ₂) ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH ₂ (3-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8g)
SCH ₂ Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8g)
S(O)CH ₂ Pen-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8h)
S(O) ₂ CH ₂ Pen-c	S(O) ₂ CH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8h)
SCH(Me)Pen-c	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-15)
S(CH ₂) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ (4-MeO-Ph)	S(O)CH ₂ (D-15)
SCH ₂ Hex-c	S(O) ₂ CH ₂ (4-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-15)
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
S(CH ₂) ₂ Hex-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
SCH ₂ CN	S(O) ₂ CH(Me)(4-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH(Me)(D-15)
S(O)CH ₂ CN	SCH ₂ C(O)Me	S(CH ₂) ₂ (D-15)

5 Tabla 11

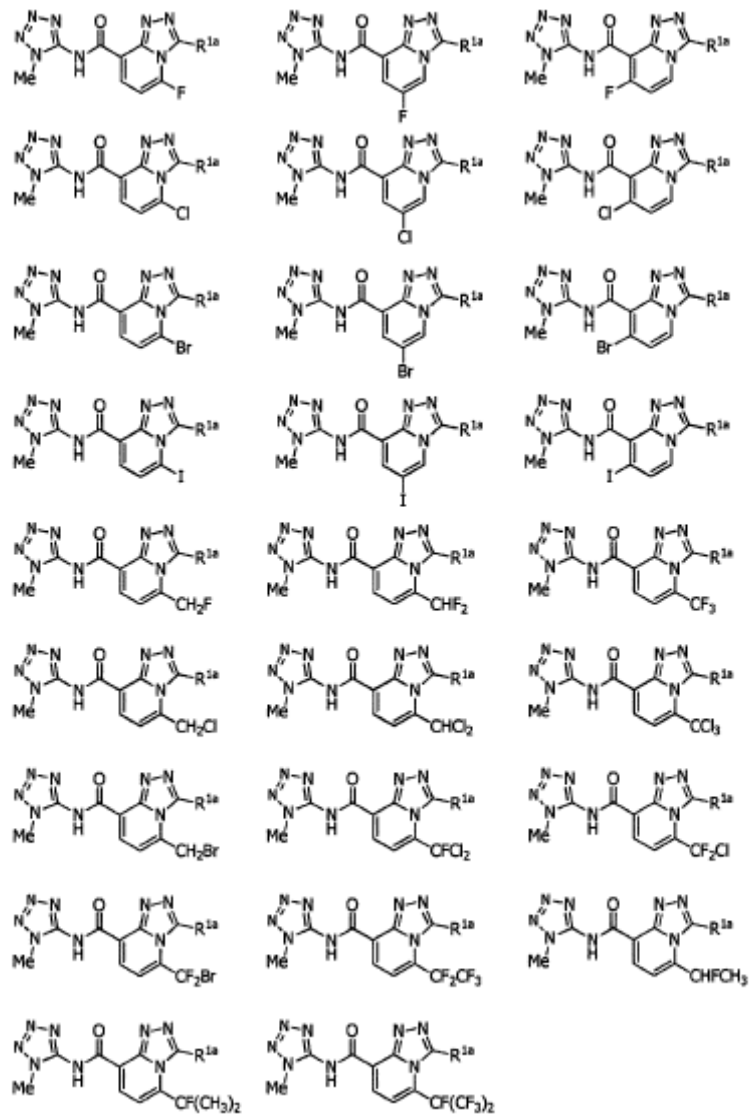
R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O)(CH ₂) ₂ (D-15)	N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ (D-15)	N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c
SCH ₂ (D-18)	N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)
S(O)CH ₂ (D-18)	N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)
S(O) ₂ CH ₂ (D-18)	N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n
SCH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i
S(O)CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c
S(O) ₂ CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s
S(CH ₂) ₂ (D-18)	N(Me)Pen-n	NHCH ₂ OMe
S(O)(CH ₂) ₂ (D-18)	N(Me)Pen-i	NHCH ₂ OEt
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ (D-18)	N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe
NHMe	N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt
NHEt	N(Me)Pen-t	NHC(Me) ₂ OMe
NHPr-n	N(Me)(3-Pen)	NHC(Me) ₂ OEt
NHPr-i	N(Me)Hex-n	NH(CH ₂) ₂ OMe
NHPr-c	N(Me)Hex-c	NH(CH ₂) ₂ OEt
NH(D-16)	N(Et)Et	NH(CH ₂) ₂ OPr-n
NH(D-16e)	N(Et)Pr-n	NH(CH ₂) ₂ OPr-i
NHBu-n	N(Et)Pr-i	N(Me)CH ₂ OMe
NHBu-i	N(Et)Pr-c	N(Me)CH ₂ OEt
NHBu-c	N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe

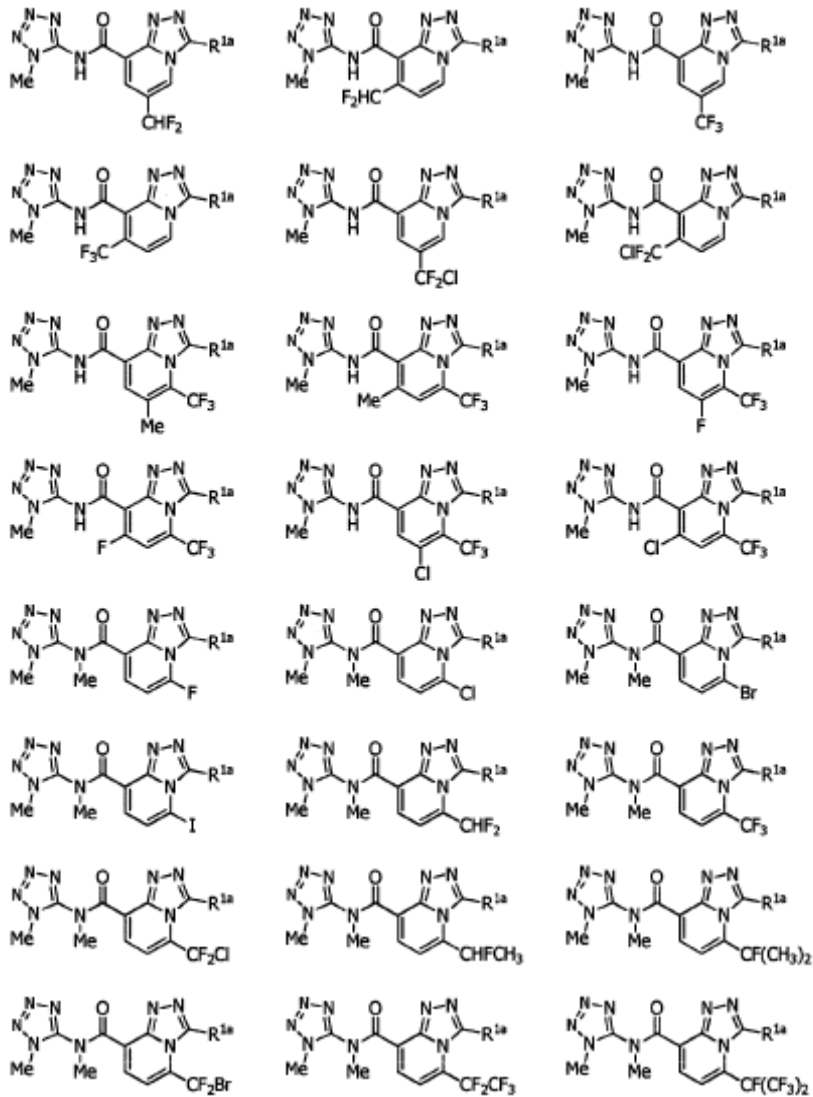
NHBU-s	N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt
NHBU-t	N(Et)Bu-n	N(Me)C(Me) ₂ OMe
NHPen-n	N(Et)Bu-i	N(Me)C(Me) ₂ OEt
NHPen-i	N(Et)Bu-c	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe
NHPen-c	N(Et)Bu-s	N(Me)(CH ₂) ₂ OEt
NHPen-s	N(Pr-n)Pr-n	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-n
NHPen-t	N(Pr-n)Pr-i	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-i
NH(3-Pen)	N(Pr-n)Pr-c	N(Et)C(Me) ₂ OMe
NHHex-n	N(Pr-n)(D-16)	N(Et)C(Me) ₂ OEt
NHHex-c	N(Pr-n)(D-16e)	N(Et)(CH ₂) ₂ OMe
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OMe

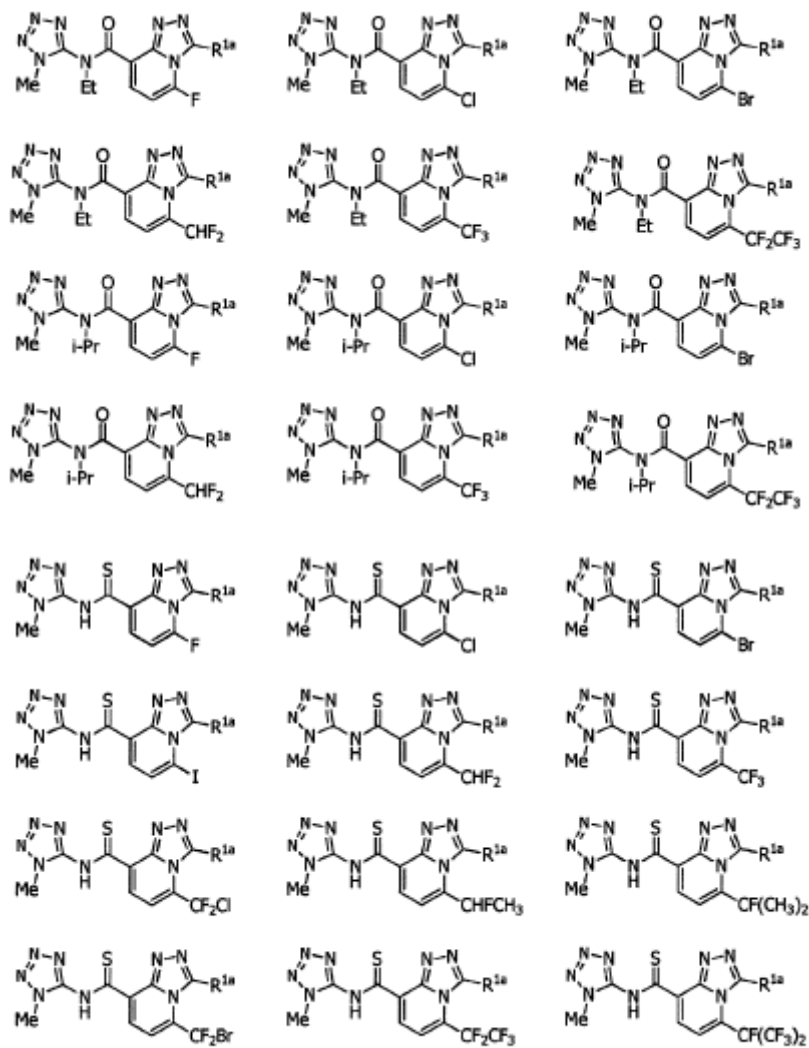
Tabla 12

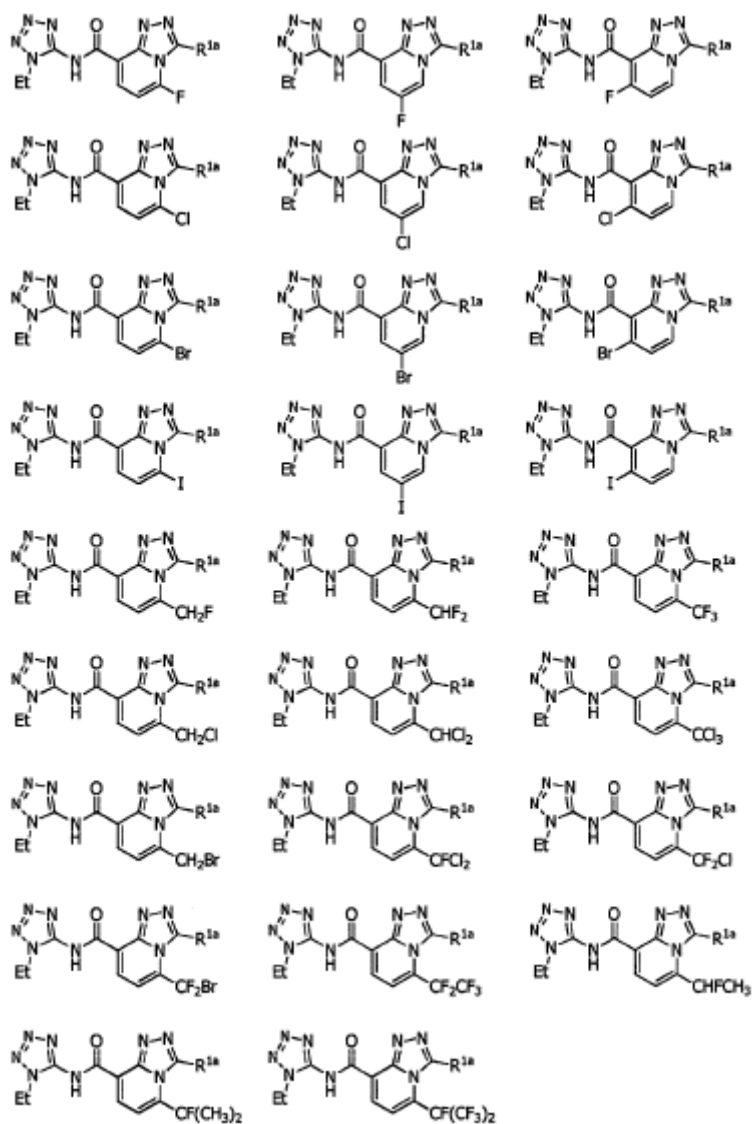
R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OEt	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	NH(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-n	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	NH(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-i	NHCF ₂ H	NH(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OMe	NHCF ₃	N(Me)ph
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OEt	NHCH ₂ CF ₂ H	N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-n	NHCH ₂ CF ₃	N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-i	NH(CH ₂) ₂ CF ₃	N(Me)(4-MeO-Ph)
NHCH ₂ SMe	NH(CH ₂) ₂ Cl	N(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
NHCH ₂ SEt	NH(CH ₂) ₃ Cl	N(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
NHCH(Me)SMe	N(Me)CF ₂ H	N(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
NHCH(Me)SEt	N(Me)CF ₃	N(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
NHC(Me) ₂ SMe	N(Me)CH ₂ CF ₂ H	N(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
NHC(Me) ₂ SEt	N(Me)CH ₂ CF ₃	N(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
NH(CH ₂) ₂ SMe	N(Me)(CH ₂) ₂ CF ₃	NHCH ₂ Ph
NH(CH ₂) ₂ S(O)Me	N(Me)(CH ₂) ₂ Cl	NHCH ₂ (2-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	N(Me)(CH ₂) ₃ Cl	NHCH ₂ (3-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ SEt	NHCH ₂ CH=CH ₂	NHCH ₂ (4-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O)Et	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	N(Me)CH ₂ Ph
NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	NHCH ₂ C≡CH	N(Me)CH ₂ (2-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ SPr-i	NHCH ₂ C=CMe	N(Me)CH ₂ (3-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	N(Me)CH ₂ C≡CH	N(Me)CH ₂ (4-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	N(Me)CH ₂ C≡CMe	NH(D-9b)
N(Me)CH ₂ SMe	NHCH ₂ CN	NH(D-9e)
N(Me)CH ₂ SEt	NH(CH ₂) ₂ CN	NH(D-9h)
N(Me)CH(Me)SMe	NH(CH ₂) ₃ CN	NH(D-9k)
N(Me)CH(Me)SEt	N(Me)CH ₂ CN	N(Me)(D-9b)
N(Me)C(Me) ₂ SMe	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	N(Me)(D-9e)
N(Me)C(Me) ₂ SEt	N(Me)(CH ₂) ₃ CN	N(Me)(D-9h)
N(Me)(CH ₂) ₂ SMe	NHPh	N(Me)(D-9k)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Me	NH(2-MeO-Ph)	NHSO ₂ Ph
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	NH(3-MeO-Ph)	N(Me)SO ₂ Ph
N(Me)(CH ₂) ₂ SEt	NH(4-MeO-Ph)	
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Et	NH(2,3-(MeO) ₂ -Ph)	
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	NH(2,4-(MeO) ₂ -Ph)	
N(Me)(CH ₂) ₂ SPr-i	NH(2,5-(MeO) ₂ -Ph)	

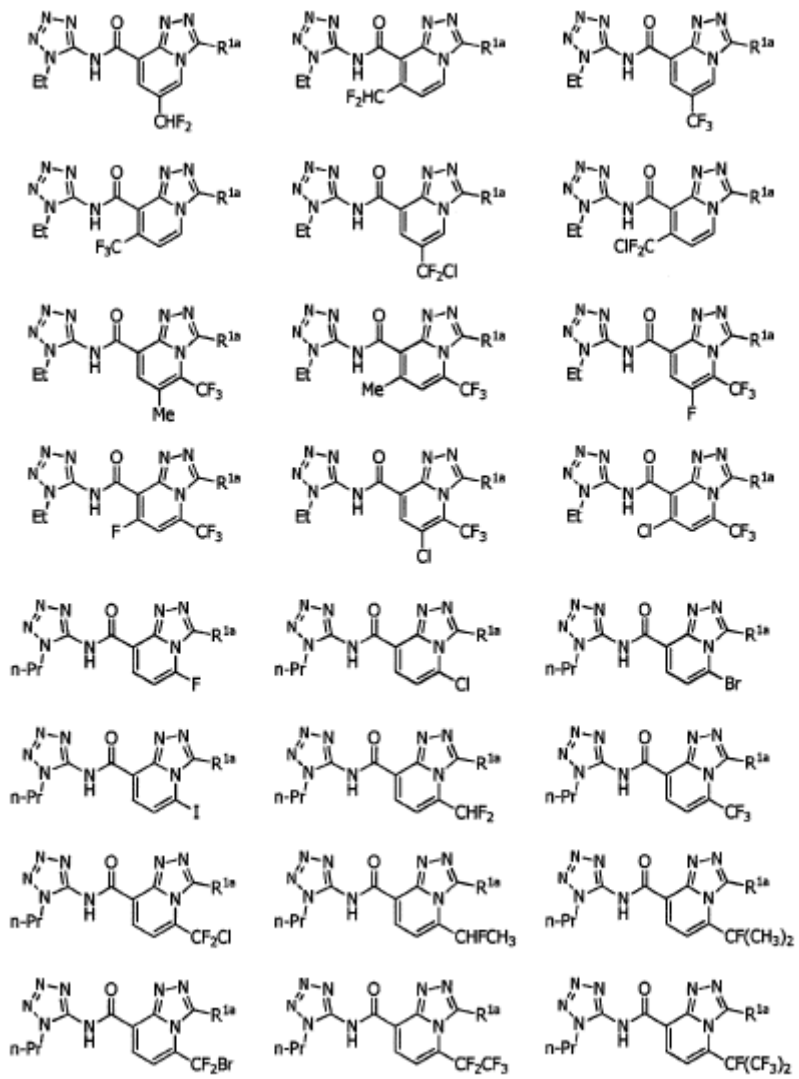
5 Segunda tabla

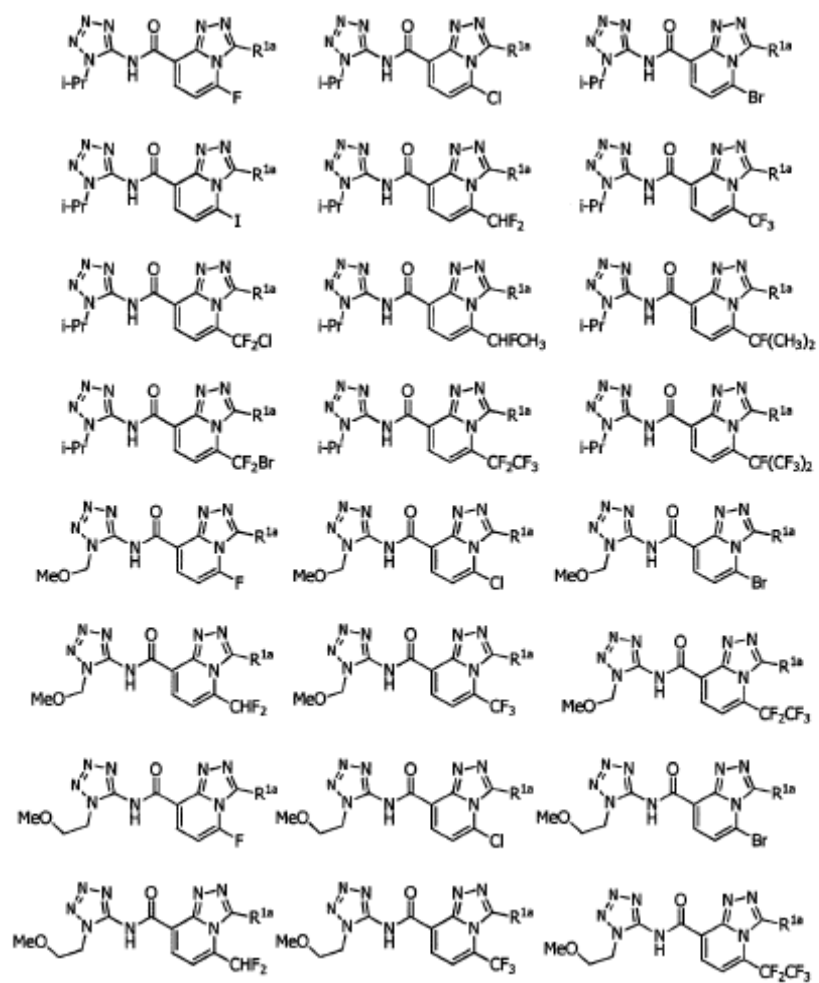


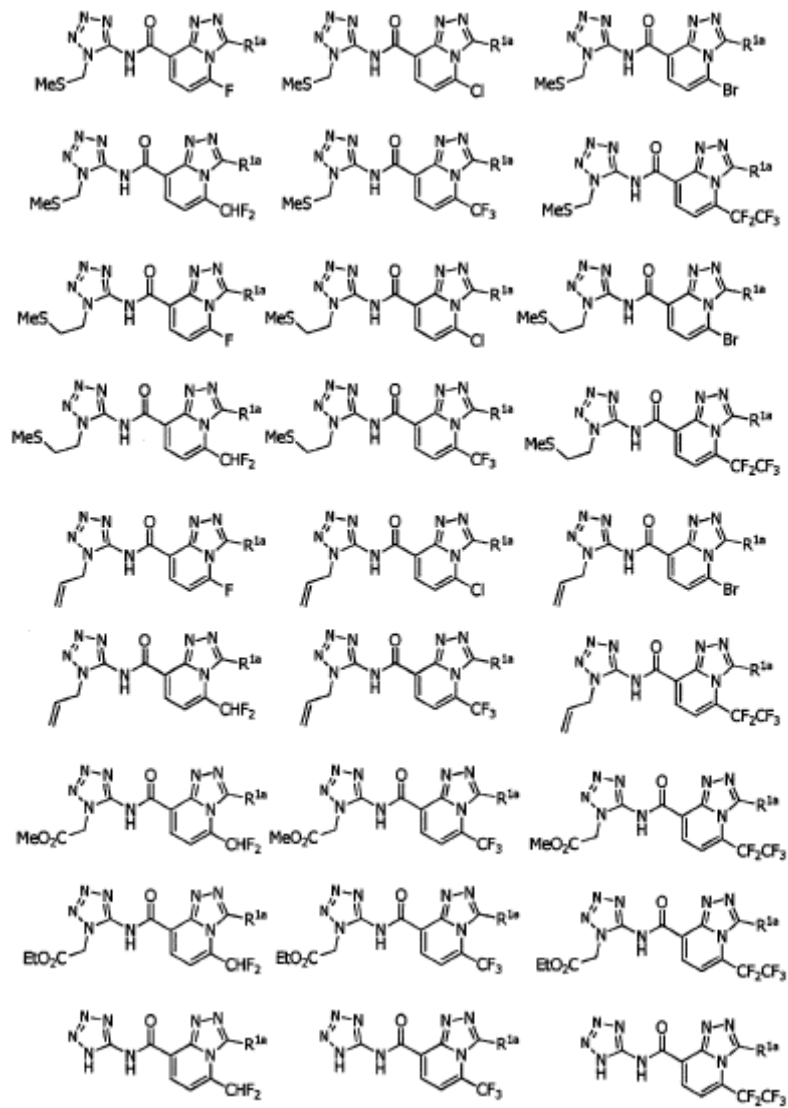












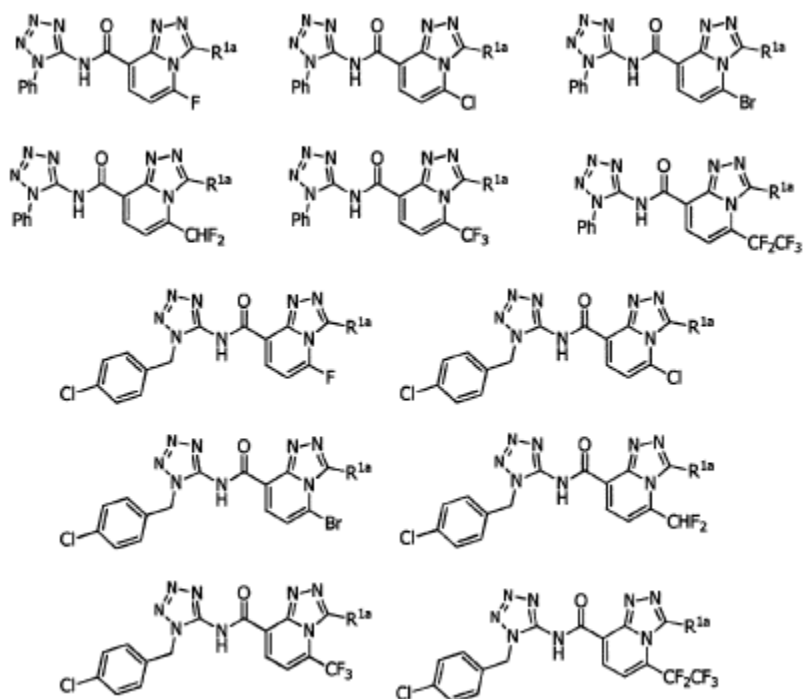


Tabla 13

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
H	CH ₂ OHex-n	C(Me) ₂ OMe
F	CH(Me)OMe	C(Me) ₂ OEt
Cl	CH(Me)OEt	C(Me) ₂ OPr-n
Br	CH(Me)OPr-n	C(Me) ₂ OPr-i
I	CH(Me)OPr-i	C(Me) ₂ OBu-n
Me	CH(Me)OBu-n	C(Me) ₂ OBu-i
Et	CH(Me)OBu-i	C(Me) ₂ OBu-s
Pr-n	CH(Me)OBu-s	C(Me) ₂ OBu-t
Pr-i	CH(Me)OBu-t	(CH ₂) ₂ OMe
Pr-c	CH(Me)OPen-n	(CH ₂) ₂ OEt
Bu-n	CH(Me)OPen-i	(CH ₂) ₂ OPr-n
Bu-i	CH(Me)OPen-s	(CH ₂) ₂ OPr-i
Bu-c	CH(Me)OPen-t	(CH ₂) ₂ OBu-n
Bu-s	CH(Me)OHex-n	(CH ₂) ₂ OBu-i
Bu-t	CH(Et)OMe	(CH ₂) ₂ OBu-s
Pen-n	CH(Et)OEt	(CH ₂) ₂ OBu-t
Pen-i	CH(Et)OPr-n	CH(Me)CH ₂ OMe
Pen-c	CH(Et)OPr-i	CH(Me)CH ₂ OEt
Pen-s	CH(Et)OBu-n	CH(Me)CH ₂ OPr-n
Pen-t	CH(Et)OBu-i	CH(Me)CH ₂ OPr-i
3-Pen	CH(Et)OBu-s	CH(Me)CH ₂ OBu-n
Hex-n	CH(Et)OBu-t	CH(Me)CH ₂ OBu-i
Hex-c	CH(Et)OPen-n	CH(Me)CH ₂ OBu-s
CH ₂ OMe	CH(Et)OPen-i	CH(Me)CH ₂ OBu-t
CH ₂ OEt	CH(Et)OPen-s	CH(Et)CH ₂ OMe
CH ₂ OPr-n	CH(Et)OPen-t	CH(Et)CH ₂ OEt
CH ₂ OPr-i	CH(Et)OHex-n	(CH ₂) ₃ OMe
CH ₂ OBu-n	CH(Pr-n)OMe	(CH ₂) ₃ OEt
CH ₂ OBu-i	CH(Pr-n)OEt	(CH ₂) ₃ OPr-n
CH ₂ OBu-s	CH(Pr-n)OPr-n	(CH ₂) ₃ OPr-i
CH ₂ OBu-t	CH(Pr-n)OPr-i	(CH ₂) ₃ OBu-n
CH ₂ OPen-n	CH(Pr-i)OMe	(OH ₂) ₃ OBu-i
CH ₂ OPen-i	CH(Pr-i)OEt	(CH ₂) ₃ OBu-s
CH ₂ OPen-s	CH(Pr-i)OPr-n	(CH ₂) ₃ OBu-t
CH ₂ OPen-t	CH(Pr-i)OPr-i	CH ₂ OCF ₂ H

Tabla 14

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH ₂ OCF ₃	CH(iPr)OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-n
CH ₂ OCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OPr-i
CH ₂ OCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
CH ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
CH ₂ O(CH ₂) ₂ Cl	(CH ₂) ₃ OH	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n
CH ₂ O(CH ₂) ₂ Br	CH ₂ OCH ₂ OMe	C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Me)OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₂ OEt	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe
CH(Me)OCF ₃	CH ₂ OCH ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OEt
CH(Me)OCH ₂ CF ₂ H	CH ₂ OCH ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-n
CH(Me)OCH ₂ CF ₃	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	(CH ₂) ₂ OCH ₂ OPr-i
CH(Et)O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
CH(Me)O(CH ₂) ₂ Cl	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
CH(Me)O(CH ₂) ₂ Br	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-n
CH(Et)OCF ₂ H	CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OMe	(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Et)OCF ₃	CH ₂ OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OMe
CH(Et)OCH ₂ CF ₂ H	CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ OCH ₂ OEt
CH(Et)OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
CH(Et)O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ OCH(Me)OMe	CH(Me)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
CH(Et)O(CH ₂) ₂ Cl	CH ₂ OCH(Me)OEt	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OMe
CH(Et)O(CH ₂) ₂ Br	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	CH(Et)CH ₂ OCH ₂ OEt
C(Me) ₂ OCF ₂ H	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OEt	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe
C(Me) ₂ OCF ₃	CH(Me)OCH ₂ OMe	CH(Et)CH ₂ O(CH ₂) ₂ OEt
C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)OCH ₂ OEt	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OMe
C(Me) ₂ OCH ₂ CF ₃	CH(Me)OCH ₂ OPr-n	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OEt
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)OCH ₂ OPr-i	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-n
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OMe	CH(Et)O(CH ₂) ₂ OPr-i
C(Me) ₂ O(CH ₂) ₂ Br	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OEt	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OMe
(CH ₂) ₂ OCF ₃	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-n	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OEt
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-n
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CF ₃	CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OMe	CH(Pr-n)O(CH ₂) ₂ OPr-i
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Cl	CH(Me)OCH(Me)CH ₂ OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OMe
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ Br	CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OEt
CH ₂ OH	CH(Me)OCH ₂ CH(Me)OEt	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-n
CH(Me)OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OMe	CH(Pr-i)O(CH ₂) ₂ OPr-i
CH(Et)OH	C(Me) ₂ OCH ₂ OEt	CH ₂ OC(O)Me

5 Tabla 15

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH ₂ OC(O)Et	CH(Et)C(O)Et	CH ₂ S(O)Pen-n
CH ₂ OC(O)Pr-i	CH(Et)C(O)OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Pen-n
CH(Me)OC(O)Me	CH(Et)C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ SPen-i
CH(Me)OC(O)Et	CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ S(O)Pen-i
CH(Me)OC(O)Pr-i	CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O) ₂ Pen-i
CH(Et)OC(O)Me	CH(Et)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ SPen-s
CH(Et)OC(O)Et	(CH ₂) ₂ C(O)OMe	CH ₂ S(O)Pen-s
CH(Et)OC(O)Pr-i	(CH ₂) ₂ C(O)OEt	CH ₂ S(O) ₂ Pen-s
CH ₂ OPh	(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ SPen-t
CH(Me)OPh	(CH ₂) ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O)Pen-t
CH ₂ C(O)OMe	CH ₂ SMe	CH ₂ S(O) ₂ Pen-t
CH ₂ C(O)OEt	CH ₂ S(O)Me	CH ₂ SHex-n
CH ₂ C(O)OPr-n	CH ₂ S(O) ₂ Me	CH(Me)SMe
CH ₂ C(O)OPr-i	CH ₂ SEt	CH(Me)S(O)Me
CH ₂ C(O)OBu-n	CH ₂ S(O)Et	CH(Me)S(O) ₂ Me
CH ₂ C(O)OBu-i	CH ₂ S(O) ₂ Et	CH(Me)SEt
CH ₂ C(O)OBu-s	CH ₂ SPr-n	CH(Me)S(O)Et
CH ₂ C(O)OBu-t	CH ₂ S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ Et
CH ₂ C(O)OPen-n	CH ₂ S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SPr-n
CH ₂ C(O)OPen-i	CH ₂ SPr-i	CH(Me)S(O)Pr-n
CH ₂ C(O)OPen-s	CH ₂ S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ Pr-n
CH ₂ C(O)OPen-t	CH ₂ S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SPr-i

CH ₂ C(O)OHex-n	CH ₂ SBu-n	CH(Me)S(O)Pr-i
CH ₂ C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ S(O)Bu-n	CH(Me)S(O) ₂ Pr-i
CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-n	CH(Me)SBu-n
CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ SBu-i	CH(Me)S(O)Bu-n
CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O)Bu-i	CH(Me)S(O) ₂ Bu-n
CH(Me)C(O)OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-i	CH(Me)SBu-i
CH(Me)C(O)OEt	CH ₂ SBu-s	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Me)C(O)OPr-i	CH ₂ S(O)Bu-s	CH(Me)S(O) ₂ Bu-i
CH(Me)C(O)OCH ₂ OMe	CH ₂ S(O) ₂ Bu-s	CH(Me)SBu-s
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ SBu-t	CH(Me)S(O)Bu-s
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ S(O)Bu-t	CH(Me)S(O) ₂ Bu-s
CH(Me)C(O)O(CH ₂) ₂ OPr-i	CH ₂ S(O) ₂ Bu-t	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)Me	CH ₂ SPen-n	CH(Me)S(O)Bu-t

Tabla 16

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Me)S(O) ₂ Bu-t	C(Me) ₂ SBu-t	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Me
CH(Me)SPen-n	C(Me) ₂ S(O)Bu-t	CH(Me)CH ₂ SEt
CH(Me)S(O)Pen-n	C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-t	CH(Me)CH ₂ S(O)Et
CH(Me)S(O) ₂ Pen-n	C(Me) ₂ SPen-n	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Et
CH(Me)SPen-i	C(Me) ₂ S(O)Pen-n	CH(Me)CH ₂ SPr-n
CH(Me)S(O)Pen-i	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-n	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-n
CH(Me)S(O) ₂ Pen-i	C(Me) ₂ SPen-i	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-n
CH(Me)SPen-s	C(Me) ₂ S(O)Pen-i	CH(Me)CH ₂ SPr-i
CH(Me)S(O)Pen-s	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-i	CH(Me)CH ₂ S(O)Pr-i
CH(Me)S(O) ₂ Pen-s	C(Me) ₂ SPen-s	CH(Me)CH ₂ S(O) ₂ Pr-i
CH(Me)SPen-t	C(Me) ₂ S(O)Pen-s	CH(Et)CH ₂ SMe
CH(Me)S(O)Pen-t	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-s	CH(Et)CH ₂ S(O)Me
CH(Me)S(O) ₂ Pen-t	C(Me) ₂ SPen-t	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Me
CH(Me)SHex-n	C(Me) ₂ S(O)Pen-t	CH(Et)CH ₂ SEt
C(Me) ₂ SMe	C(Me) ₂ S(O) ₂ Pen-t	CH(Et)CH ₂ S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Me	(CH ₂) ₂ SMe	CH(Et)CH ₂ S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Me	(CH ₂) ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ CH ₂ SMe
C(Me) ₂ SEt	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)Et	(CH ₂) ₂ SEt	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ Et	(CH ₂) ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ CH ₂ SEt
C(Me) ₂ SPr-n	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Pr-n	(CH ₂) ₂ SPr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-n	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-n
C(Me) ₂ SPr-i	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-n	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-n
C(Me) ₂ S(O)Pr-i	(CH ₂) ₂ SPr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-n
C(Me) ₂ S(O) ₂ Pr-i	(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ SPr-i
C(Me) ₂ SBu-n	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Pr-i
C(Me) ₂ S(O)Bu-n	(CH ₂) ₃ SMe	C(Me) ₂ CH ₂ S(O) ₂ Pr-i
C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-n	(CH ₂) ₃ S(O)Me	CH(Et)SMe
C(Me) ₂ SBu-i	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Me	CH(Et)S(O)Me
C(Me) ₂ S(O)Bu-i	(CH ₂) ₃ SEt	CH(Et)S(O) ₂ Me
C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-i	(CH ₂) ₃ S(O)Et	CH(Et)SEt
C(Me) ₂ SBu-s	(CH ₂) ₃ S(O) ₂ Et	CH(Et)S(O)Et
C(Me) ₂ S(O)Bu-s	CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Et)S(O) ₂ Et
C(Me) ₂ S(O) ₂ Bu-s	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Et)SPr-n

5 Tabla 17

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
CH(Et)S(O)Pr-n	CH ₂ SCH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)S(O) ₂ Pr-n	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Et)SPr-i	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)S(O)Pr-i	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH(Et)S(O) ₂ Pr-i	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-n)SMe	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)S(O)Me	CH ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)S(O) ₂ Me	CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-n)SEt	CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ SCF ₂ H

CH(Pr-n)S(O)Et	CH ₂ S(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O)CF ₂ H
CH(Pr-n)S(O) ₂ Et	CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)SPr-n	CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	C(Me) ₂ SCF ₃
CH(Pr-n)S(O)Pr-n	CH ₂ S(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O)CF ₃
CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-n	CH ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ S(O) ₂ CF ₃
CH(Pr-n)SPr-i	CH ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)S(O)Pr-i	CH ₂ SCHFCH ₃	C(Me) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-n)S(O) ₂ Pr-i	CH ₂ SCF ₂ CH ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H
CH(Pr-i)SMe	CH ₂ SCF(CH ₃) ₂	C(Me) ₂ SCH ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O)Me	CH ₂ SCF ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)H ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O) ₂ Me	CH ₂ SCF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Pr-i)SEt	CH ₂ SCF ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O)Et	CH ₂ SCF(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)S(O) ₂ Et	CH(Me)SCF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
CH(Pr-i)SPr-n	CH(Me)S(O)CF ₂ H	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	CH(Me)S(O) ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-n	CH(Me)SCF ₃	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl
CH(Pr-i)SPr-i	CH(Me)S(O)CF ₃	C(Me) ₂ S(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	CH(Me)S(O) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br
CH(Pr-i)S(O) ₂ Pr-i	CH(Me)SCH ₂ CF ₂ H	C(Me) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br
CH ₂ SCF ₂ H	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ SCF ₃
CH ₂ S(O)CF ₂ H	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ S(O)CF ₃
CH ₂ S(O) ₂ CF ₂ H	CH(Me)SCH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CF ₃
CH ₂ SCF ₃	CH(Me)S(O)CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O)CF ₃	CH(Me)S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₂ H
CH ₂ S(O) ₂ CF ₃	CH(Me)S(CH ₂) ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₂ H

Tabla 18

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
(CH ₂) ₂ SCH ₂ CF ₃	3-Cl-Ph	2-Cl-3-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	4-Cl-Ph	2-Cl-4-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	2-Br-Ph	2-Cl-5-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Cl	3-Br-Ph	3-Cl-4-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Cl	4-Br-Ph	3-Cl-5-Me-Ph
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	2-Me-Ph	2-Cl-3-F-Ph
(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ Br	3-Me-Ph	2-Cl-4-F-Ph
(CH ₂) ₂ S(O)(CH ₂) ₂ Br	4-Me-Ph	2-Cl-5-F-Ph
(CH ₂) ₂ S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Br	2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph
CH=CH ₂	3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph
CH=CHMe	4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph
CH=CMe ₂	2,3-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Me-Ph
CH ₂ CH=CH ₂	2,4-(F) ₂ -Ph	2-F-5-Me-Ph
CH ₂ CH=CHMe	2,5-(F) ₂ -Ph	3-F-4-Me-Ph
CH ₂ C(Me)=CH ₂	2,6-(F) ₂ -Ph	3-F-5-Me-Ph
(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂	3,4-(F) ₂ -Ph	2-F-3-Cl-Ph
C(Me)=CH ₂	3,5-(F) ₂ -Ph	2-F-4-Cl-Ph
C(Me)=CHMe	2,3-(Cl) ₂ -Ph	2-F-5-Cl-Ph
C(Me)=CMe ₂	2,4-(Cl) ₂ -Ph	3-F-4-Cl-Ph
CH(Me)CH=CH ₂	2,5-(Cl) ₂ -Ph	3-F-5-Cl-Ph
C(Et)=CH ₂	2,6-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-3-F-Ph
C(Et)=CHMe	3,4-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-4-F-Ph
C(Et)=CMe ₂	3,5-(Cl) ₂ -Ph	2-Me-5-F-Ph
CH(Et)CH=CH ₂	2,3-(Me) ₂ -Ph	3-Me-4-F-Ph
C≡CH	2,4-(Me) ₂ -Ph	3-Me-5-F-Ph
C≡CMe	2,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH ₂ C≡CH	2,6-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
CH ₂ C≡CMe	3,4-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
CH(Me)C≡CH	3,5-(Me) ₂ -Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,3-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
Ph	2,4-(MeO) ₂ -Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	2,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-F-Ph	2,6-(MeO) ₂ -Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-F-Ph	3,4-(MeO) ₂ -Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	3,5-(MeO) ₂ -Ph	2-F-6-MeO-Ph

Tabla 19

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
3-F-4-MeO-Ph	D-8	CH ₂ (2,4-(MeO) ₂ -Ph)
3-F-5-MeO-Ph	D-8a	CH ₂ (2,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-3-F-Ph	D-8b	CH ₂ (2,6-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-4-F-Ph	D-8c	CH ₂ (3,4-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-5-F-Ph	D-8d	CH ₂ (3,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-6-F-Ph	D-8e	CH(Me)(2-MeO-Ph)
3-MeO-4-F-Ph	D-8f	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-5-F-Ph	D-8g	CH(Me)(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Cl-Ph	D-8h	CH(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-4-Cl-Ph	D-10a	CH(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-5-Cl-Ph	D-11	CH(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-MeO-6-Cl-Ph	D-14	CH(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
3-MeO-4-Cl-Ph	D-16	CH(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
3-MeO-5-Cl-Ph	D-16a	CH(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
2-Me-3-MeO-Ph	D-16b	CH(Et)(2-MeO-Ph)
2-Me-4-MeO-Ph	D-16c	CH(Et)(3-MeO-Ph)
2-Me-5-MeO-Ph	D-16d	CH(Et)(4-MeO-Ph)
2-Me-6-MeO-Ph	D-16e	(CH ₂) ₂ (2-MeO-Ph)
3-Me-4-MeO-Ph	D-16f	(CH ₂) ₂ (3-MeO-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-16g	(CH ₂) ₂ (4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-16h	CHO
2-MeO-4-Me-Ph	D-16i	SMe
2-MeO-5-Me-Ph	D-16j	S(O)Me
2-MeO-6-Me-Ph	D-16k	S(O) ₂ Me
3-MeO-4-Me-Ph	D-16m	SEt
3-MeO-5-Me-Ph	D-16n	S(O)Et
3,5-(F) ₂ -4-Me-Ph	D-16p	S(O) ₂ Et
3,5-(F) ₂ -4-MeO-Ph	D-17	SPr-n
3,4,5-(MeO) ₃ -Ph	D-17a	S(O)Pr-n
D-3	D-17b	S(O) ₂ Pr-n
D-3a	CH ₂ Ph	SPr-i
D-4	CH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O)Pr-i
D-4a	CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O) ₂ Pr-i
D-4b	CH ₂ (4-MeO-Ph)	SPr-c
D-5	CH ₂ (2,3-(MeO) ₂ -Ph)	S(O)Pr-c

Tabla 20

5

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(O) ₂ Pr-c	S(O)Pen-t	SCHFCH ₃
S(D-16)	S(O) ₂ Pen-t	SCF ₂ CH ₃
S(O)(D-16)	SHex-n	SCF(CH ₃) ₂
S(O) ₂ (D-16)	SHex-c	SCF ₂ CF ₂ H
S(D-16e)	SCH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₃
S(O)(D-16e)	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₂ CF ₂ CF ₃
S(O) ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ CH=H ₂	SCF(CF ₃)
SBu-n	SCH(Me)CH=CH ₂	SCH ₂ OMe
S(O)Bu-n	SC(Me) ₂ CH=CH ₂	S(CH ₂) ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-n	SCH ₂ CH=CHMe	S(O)(CH ₂) ₂ OMe
SBu-i	SCH ₂ C(Me)=CH ₂	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OMe
S(O)Bu-i	S(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂	SCH(Me)CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-i	SC(Me)=CH ₂	S(O)CH(Me)CH ₂ OMe
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	S(O) ₂ CH(Me)CH ₂ OMe
S(O)Bu-c	SCH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH(Me)OMe
S(O) ₂ Bu-c	S(O)CH ₂ C-CH	S(O)CH ₂ CH(Me)OMe
SBu-s	S(O) ₂ CH ₂ C≡CH	S(O) ₂ CH ₂ CH(Me)OMe
S(O)Bu-s	SCH(Me)C≡CH	SC(Me) ₂ CH ₂ OMe
S(O) ₂ Bu-s	SC(Me) ₂ C≡CH	S(CH ₂) ₃ OMe
SBu-t	SCH ₂ C≡CMe	SCH ₂ OEt
S(O)Bu-t	SCH ₂ Cl	S(CH ₂) ₂ OEt
S(O) ₂ Bu-t	SCH(Me)Cl	S(O)(CH ₂) ₂ OEt
SPen-n	S(CH ₂) ₂ Cl	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OEt

S(O)Pen-n	S(O)(CH ₂) ₂ Cl	SCH(Me)CH ₂ OEt
S(O) ₂ Pen-n	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ Cl	SCH ₂ OPr-i
SPen-i	SCH(Me)CH ₂ Cl	S(CH ₂) ₂ OPr-i
S(O)Pen-i	SCH ₂ CH(Me)Cl	S(O)(CH ₂) ₂ OPr-i
S(O) ₂ Pen-i	S(CH ₂) ₃ Cl	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ OPr-i
SPen-c	SCF ₃	SCH(Me)CH ₂ OPr-i
S(O)Pen-c	SCH ₂ CF ₃	SCH ₂ Pr-c
S(O) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ CF ₃	S(O)CH ₂ Pr-c
SPen-s	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	S(O) ₂ CH ₂ Pr-c
S(O)Pen-s	SCH(Me)CF ₃	SCH(Me)Pr-c
S(O) ₂ Pen-s	S(CH ₂) ₂ CF ₃	S(O)CH(Me)Pr-c
SPen-t	S(CH ₂) ₃ CF ₃	S(O) ₂ CH(Me)Pr-c

Tabla 21

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
S(CH ₂) ₂ Pr-c	SCH(Me)Ph	SCH ₂ (D-8f)
SCH ₂ (D-16)	S(O)CH(Me)Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8f)
S(O)CH ₂ (D-16)	S(O) ₂ CH(Me)Ph	SCH ₂ (D-8g)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16)	SCH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8g)
SCH ₂ (D-16e)	S(O)CH ₂ (2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-8h)
S(O)CH ₂ (D-16e)	S(O) ₂ CH ₂ (2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-8h)
S(O) ₂ CH ₂ (D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH ₂ (D-15)
SCH ₂ Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O)CH ₂ (D-15)
S(O)CH ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH(Me)(2-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH ₂ (D-15)
S(O) ₂ CH ₂ Bu-c	SCH ₂ (3-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
SCH(Me)Bu-c	S(O)CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
S(CH ₂) ₂ Bu-c	S(O) ₂ CH ₂ (3-MeO-Ph)	S(O) ₂ CH(Me)(D-15)
SCH ₂ Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	S(CH ₂) ₂ (D-15)
S(O)CH ₂ Pen-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O)(CH ₂) ₂ (D-15)
S(O) ₂ CH ₂ Pen-c	S(O) ₂ CH(Me)(3-MeO-Ph)	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ (D-15)
SCH(Me)Pen-c	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	NHMe
S(CH ₂) ₂ Pen-c	S(O)CH ₂ (4-MeO-Ph)	NHEt
SCH ₂ Hex-c	S(O) ₂ CH ₂ (4-MeO-Ph)	NHPr-n
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-i
S(CH ₂) ₂ Hex-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-c
SCH ₂ CN	S(O) ₂ CH(Me)(4-MeO-Ph)	NH(D-16)
S(O)CH ₂ CN	SCH ₂ (D-8a)	NH(D-16e)
S(O) ₂ CH ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8a)	NHBu-n
SCH(Me)CN	S(O) ₂ CH ₂ (D-8a)	NHBu-i
S(O)CH(Me)CN	SCH ₂ (D-8b)	NHBu-c
S(O) ₂ CH(Me)CN	S(O)CH ₂ (D-8b)	NHBu-s
SC(Me) ₂ CN	S(O) ₂ CH ₂ (D-8b)	NHBu-t
S(O)C(Me) ₂ CN	SCH ₂ (D-8c)	NHPen-n
S(O) ₂ C(Me) ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8c)	NHPen-i
S(CH ₂) ₂ CN	S(O) ₂ CH ₂ (D-8c)	NHPen-c
S(O)(CH ₂) ₂ CN	SCH ₂ (D-8d)	NHPen-s
S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CN	S(O)CH ₂ (D-8d)	NHPen-t
SCH ₂ Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8d)	NH(3-Pen)
S(O)CH ₂ Ph	SCH ₂ (D-8e)	NHHex-n
S(O) ₂ CH ₂ Ph	S(O) ₂ CH ₂ (D-8e)	NHHex-c

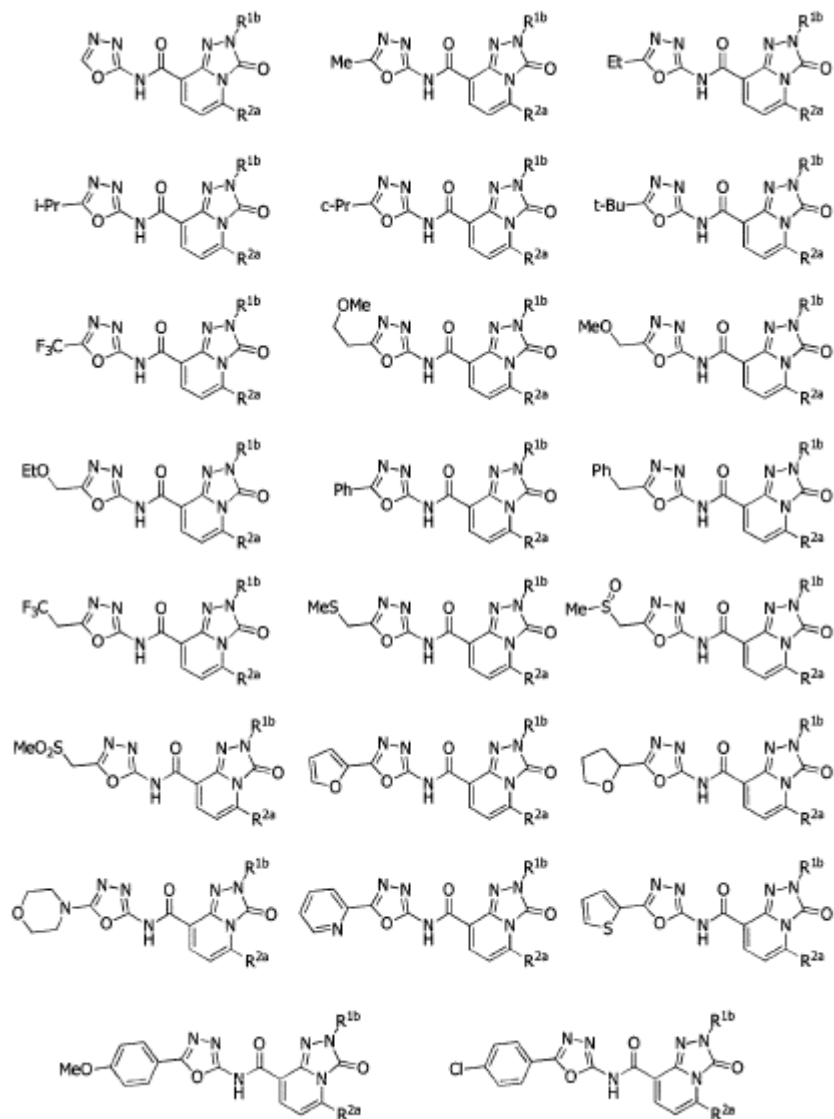
5 Tabla 22

R ^{1a}	R ^{1a}	R ^{1a}
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OMe
N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-n
N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)	N(Pr-n)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OMe
N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OEt
N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-n

N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c	N(Pr-i)(CH ₂) ₂ OPr-i
N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s	NHCH ₂ SMe
N(Me)P -n	NHCH ₂ OMe	NHCH ₂ SEt
N(Me)Pen-i	NHCH ₂ OEt	NHCH(Me)SMe
N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe	NHCH(Me)SEt
N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt	NHC(Me) ₂ SMe
N(Me)Pen-t	NHC(Me) ₂ OMe	NHC(Me) ₂ SEt
N(Me)(3-Pen)	NHC(Me) ₂ OEt	NH(CH ₂) ₂ SMe
N(Me)Hex-n	NH(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ S(O)Me
N(Me)Hex-c	NH(CH ₂) ₂ OEt	NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me
N(Et)Et	NH(CH ₂) ₂ OPr-n	NH(CH ₂) ₂ SEt
N(Et)Pr-n	NH(CH ₂) ₂ OPr-i	NH(CH ₂) ₂ S(O)Et
N(Et)Pr-i	N(Me)CH ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et
N(Et)Pr-c	N(Me)CH ₂ OEt	NH(CH ₂) ₂ SPr-i
N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe	NH(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i
N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt	NH(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i
N(Et)Bu-n	N(Me)C(Me) ₂ OMe	N(Me)CH ₂ SMe
N(Et)Bu-i	N(Me)C(Me) ₂ OEt	N(Me)CH ₂ SEt
N(Et)Bu-c	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	N(Me)CH(Me)SMe
N(Et)Bu-s	N(Me)(CH ₂) ₂ OEt	N(Me)CH(Me)SEt
N(Pr-n)Pr-n	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-n	N(Me)C(Me) ₂ SMe
N(Pr-n)Pr-i	N(Me)(CH ₂) ₂ OPr-i	N(Me)C(Me) ₂ SEt
N(Pr-n)Pr-c	N(Et)C(Me) ₂ OMe	N(Me)(CH ₂) ₂ SMe
N(Pr-n)(D-16)	N(Et)C(Me) ₂ OEt	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Me
N(Pr-n)(D-16e)	N(Et)(CH ₂) ₂ OMe	N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me

Tabla 23

R ^{1a}	R ^{1a}
N(Me)(CH ₂) ₂ SEt	NH(4-MeO-Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Et	NH(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Et	NH(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ SPr-i	NH(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O)Pr-i	NH(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Pr-i	NH(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
NHCF ₂ H	NH(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
NHCF ₃	N(Me)Ph
NHCH ₂ CF ₂ H	N(Me)(2-MeO-Ph)
NHCH ₂ CF ₃	N(Me)(3-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ CF ₃	N(Me)(4-MeO-Ph)
NH(CH ₂) ₂ Cl	N(Me)(2,3-(MeO) ₂ -Ph)
NH(CH ₂) ₃ Cl	N(Me)(2,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CF ₂ H	N(Me)(2,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CF ₃	N(Me)(2,6-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CH ₂ CF ₂ H	N(Me)(3,4-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)CH ₂ CF ₃	N(Me)(3,5-(MeO) ₂ -Ph)
N(Me)(CH ₂) ₂ CF ₃	
N(Me)(CH ₂) ₂ Cl	
N(Me)(CH ₂) ₃ Cl	
NHCH ₂ CH=CH ₂	
N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	
NHCH ₂ C≡CH	
NHCH ₂ C≡CMe	
N(Me)CH ₂ C≡CH	
N(Me)CH ₂ C≡CMe	
NHCH ₂ CN	
NH(CH ₂) ₂ CN	
NH(CH ₂) ₃ CN	
N(Me)CH ₂ CN	
N(Me)(CH ₂) ₂ CN	
N(Me)(CH ₂) ₃ CN	
NHPh	
NH(2-MeO-Ph)	
NH(3-MeO-Ph)	



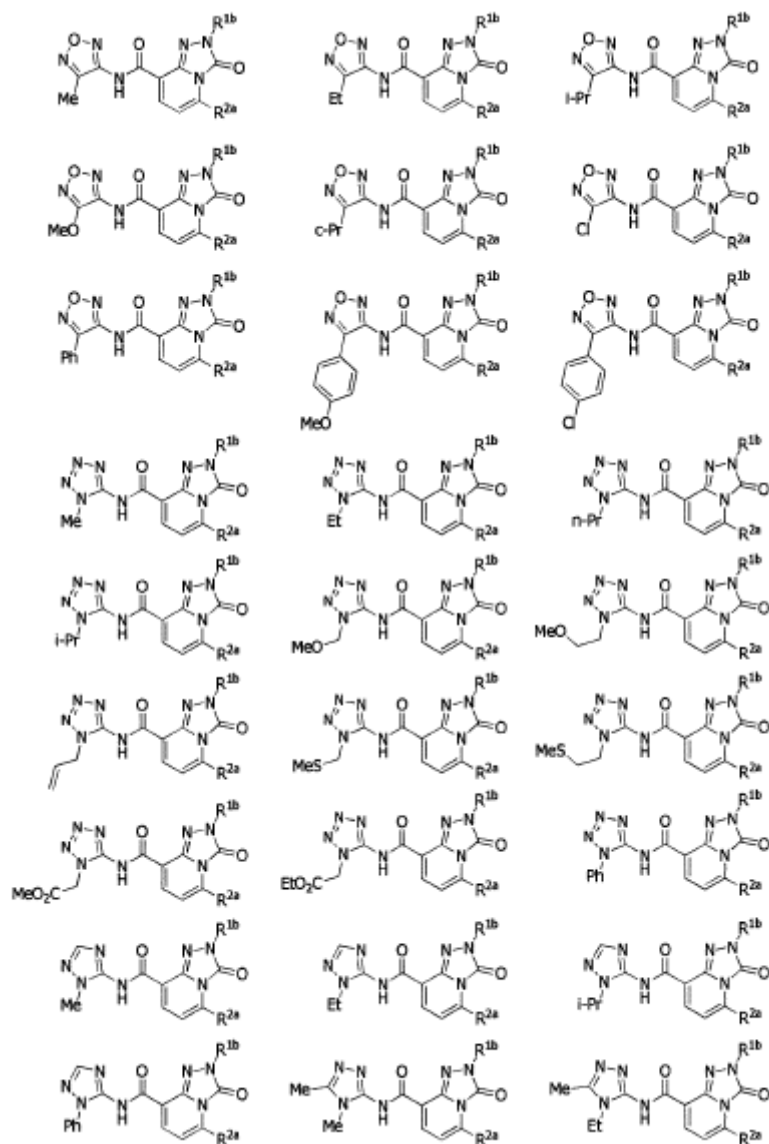


Tabla 24

R ^{2a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{1b}
CF ₂ H	Me	CF ₂ Cl	Pen-c
CF ₂ H	Et	CF ₂ Cl	Pen-s
CF ₂ H	Pr-n	CF ₂ Cl	Pen-t
CF ₂ H	Pr-i	CF ₂ Cl	3-Pen
CF ₂ H	Pr-c	CF ₂ Cl	Hex-n
CF ₂ H	Bu-n	CF ₂ Cl	Hex-c
CF ₂ H	Bu-i	CF ₂ Cl	CH ₂ Ph
CF ₂ H	Bu-c	CF ₂ Cl	CH(Me)Ph
CF ₂ H	Bu-s	CF ₂ Cl	(CH ₂) ₂ Ph
CF ₂ H	Bu-t	CF ₂ Cl	(CH ₂) ₃ Ph
CF ₂ H	Pen-n	CF ₂ Br	Me
CF ₂ H	Pen-i	CF ₂ Br	Et
CF ₂ H	Pen-c	CF ₂ Br	Pr-n
CF ₂ H	Pen-s	CF ₂ Br	Pr-i
CF ₂ H	Pen-t	CF ₂ Br	Pr-c
CF ₂ H	3-Pen	CF ₂ Br	Bu-n
CF ₂ H	Hex-n	CF ₂ Br	Bu-i
CF ₂ H	Hex-c	CF ₂ Br	Bu-c
CF ₂ H	CH ₂ Ph	CF ₂ Br	Bu-s
CF ₂ H	CH(Me)Ph	CF ₂ Br	Bu-t

CF ₂ H	(CH ₂) ₂ Ph	CF ₂ Br	CH ₂ Ph
CF ₂ H	(CH ₂) ₃ Ph	CF ₂ Br	CH(Me)Ph
CF ₂ Cl	Me	CF ₃	Me
CF ₂ Cl	Et	CF ₃	Et
CF ₂ Cl	Pr-n	CF ₃	Pr-n
CF ₂ Cl	Pr-i	CF ₃	Pr-i
CF ₂ Cl	Pr-c	CF ₃	Pr-c
CF ₂ Cl	Bu-n	CF ₃	Bu-n
CF ₂ Cl	Bu-i	CF ₃	Bu-i
CF ₂ Cl	Bu-c	CF ₃	Bu-c
CF ₂ Cl	Bu-s	CF ₃	Bu-s
CF ₂ Cl	Bu-t	CF ₃	Bu-t
CF ₂ Cl	Pen-n	CF ₃	Pen-n
CF ₂ Cl	Pen-i	CF ₃	Pen-i

Tabla 25

R ^{2a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{1b}
CF ₃	Pen-c	CHFCH ₃	Me
CF ₃	Pen-s	CHFCH ₃	Et
CF ₃	Pen-t	CHFCH ₃	Pr-n
CF ₃	3-Pen	CHFCH ₃	Pr-i
CF ₃	Hex-n	CHFCH ₃	Pr-c
CF ₃	Hex-c	CHFCH ₃	Bu-n
CF ₃	CH ₂ Ph	CHFCH ₃	Bu-i
CF ₃	CH(Me)ph	CHFCH ₃	Bu-c
CF ₃	(CH ₂) ₂ Ph	CHFCH ₃	Bu-s
CF ₃	(CH ₂) ₃ Ph	CHFCH ₃	Bu-t
CH ₂ CF ₂ H	Me	CHFCH ₃	CH ₂ Ph
CH ₂ CF ₂ H	Et	CHFCH ₃	CH(Me)Ph
CH ₂ CF ₂ H	Pr-n	CF ₂ CH ₃	Me
CH ₂ CF ₂ H	Pr-i	CF ₂ CH ₃	Et
CH ₂ CF ₂ H	Pr-c	CF ₂ CH ₃	Pr-n
CH ₂ CF ₂ H	Bu-n	CF ₂ CH ₃	Pr-i
CH ₂ CF ₂ H	Bu-i	CF ₂ CH ₃	Pr-c
CH ₂ CF ₂ H	Bu-c	CF ₂ CH ₃	Bu-n
CH ₂ CF ₂ H	Bu-s	CF ₂ CH ₃	Bu-i
CH ₂ CF ₂ H	Bu-t	CF ₂ CH ₃	Bu-c
CH ₂ CF ₂ H	CH ₂ Ph	CF ₂ CH ₃	Bu-s
CH ₂ CF ₂ H	CH(Me)Ph	CF ₂ CH ₃	Bu-t
CH ₂ CF ₃	Me	CF ₂ CH ₃	CH ₂ Ph
CH ₂ CF ₃	Et	CF ₂ CH ₃	CH(Me)Ph
CH ₂ CF ₃	Pr-n	CF(CH ₃) ₂	Me
CH ₂ CF ₃	Pr-i	CF(CH ₃) ₂	Et
CH ₂ CF ₃	Pr-c	CF(CH ₃) ₂	Pr-n
CH ₂ CF ₃	Bu-n	CF(CH ₃) ₂	Pr-i
CH ₂ CF ₃	Bu-i	CF(CH ₃) ₂	Pr-c
CH ₂ CF ₃	Bu-c	CF(CH ₃) ₂	Bu-n
CH ₂ CF ₃	Bu-s	CF(CH ₃) ₂	Bu-i
CH ₂ CF ₃	Bu-t	CF(CH ₃) ₂	Bu-c
CH ₂ CF ₃	CH ₂ Ph	CF(CH ₃) ₂	Bu-s
CH ₂ CF ₃	CH(Me)Ph	CF(CH ₃) ₂	Bu-t

5 Tabla 26

R ^{2a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{1b}
CF(CH ₃) ₂	CH ₂ Ph	CF ₂ CF ₃	Pen-n
CF(CH ₃) ₂	CH(Me)Ph	CF ₂ CF ₃	Pen-i
CF ₂ CF ₂ H	Me	CF ₂ CF ₃	Pen-c
CF ₂ CF ₂ H	Et	CF ₂ CF ₃	Pen-s
CF ₂ CF ₂ H	Pr-n	CF ₂ CF ₃	Pen-t
CF ₂ CF ₂ H	Pr-i	CF ₂ CF ₃	3-Pen
CF ₂ CF ₂ H	Pr-c	CF ₂ CF ₃	Hex-n
CF ₂ CF ₂ H	Bu-n	CF ₂ CF ₃	Hex-c
CF ₂ CF ₂ H	Bu-i	CF ₂ CF ₃	CH ₂ Ph

CF ₂ CF ₂ H	Bu-c	CF ₂ CF ₃	CH(Me)Ph
CF ₂ CF ₂ H	Bu-s	CF ₂ CF ₃	(CH ₂) ₂ Ph
CF ₂ CF ₂ H	Bu-t	CF ₂ CF ₃	(CH ₂) ₃ Ph
CF ₂ CF ₂ H	Pen-n	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me
CF ₂ CF ₂ H	Pen-i	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Et
CF ₂ CF ₂ H	Pen-c	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Pr-n
CF ₂ CF ₂ H	Pen-s	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Pr-i
CF ₂ CF ₂ H	Pen-t	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Pr-c
CF ₂ CF ₂ H	3-Pen	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-n
CF ₂ CF ₂ H	Hex-n	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-i
CF ₂ CF ₂ H	Hex-c	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-s
CF ₂ CF ₂ H	CH ₂ Ph	CF ₂ CF ₂ CF ₃	Bu-t
CF ₂ CF ₂ H	CH(Me)Ph	CF(CF ₃) ₂	Me
CF ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	Et
CF ₂ CF ₂ H	(CH ₂) ₃ Ph	CF(CF ₃) ₂	Pr-n
CF ₂ CF ₃	Me	CF(CF ₃) ₂	Pr-i
CF ₂ CF ₃	Et	CF(CF ₃) ₂	Pr-c
CF ₂ CF ₃	Pr-n	CF(CF ₃) ₂	Bu-n
CF ₂ CF ₃	Pr-i	CF(CF ₃) ₂	Bu-i
CF ₂ CF ₃	Pr-c	CF(CF ₃) ₂	Bu-s
CF ₂ CF ₃	Bu-n	CF(CF ₃) ₂	Bu-t
CF ₂ CF ₃	Bu-i		
CF ₂ CF ₃	Bu-c		
CF ₂ CF ₃	Bu-s		
CF ₂ CF ₃	Bu-t		

El compuesto de la presente invención puede usarse en ambos métodos de tratamiento de aplicación al suelo y aplicación al follaje con inundación como herbicida para arrozales. Los ejemplos de malas hierbas de arrozales pueden incluir malas hierbas de *Potamogetonaceae* representadas por *Potamogeton distinctus*; malas hierbas de *Alismataceae* representadas por *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria pygmaea* y *Sagittaria trifolia*; malas hierbas de *Gramineae* representadas por *Leptochloa chinensis*, *Echinochloa crus-galli*, *Echinochloa oryzicola*, *Homalocenchrus japonicus* y *Paspalum distichum*; malas hierbas de *Cyperaceae* representadas por *Eleocharis kuroguwai*, *Scirpus juncooides*, *Scirpus nipponicus*, *Cyperus serotinus*, *Cyperus difformis* y *Cyperus hakonensis*; malas hierbas de *Lemnaceae* representadas por *Spirodela polirhiza* y *Lemna paucicostata*; malas hierbas de *Commelinaceae* representadas por *Murdannia keisak*; malas hierbas de *Pontederiaceae* representadas por *Monochoria korsakowii* y *Monochoria vaginalis*; malas hierbas de *Elatinaceae* representadas por *Elatine triandra*; malas hierbas de *Lythraceae* representadas por *Ammannia multiflora* y *Rotala indica*; malas hierbas de *Oenotheraceae* representadas por *Lidwigia epilobioides*; malas hierbas de *Scrophulariaceae* representadas por *Dopatrium junceum*, *Gratiola japonica*, *Limnophila sessilifolia*, *Lindernia pyxidaria*, y *Lindernia dubia*; malas hierbas de *Leguminosae* tales como *Aeschynomene indica*, y malas hierbas de *Compositae* representadas por *Bidens frondosa* y *Bidens tripartita* y similares.

El compuesto de la presente invención puede usarse en cualquier método de tratamiento de tratamiento al suelo, tratamiento de incorporación al suelo y tratamiento al follaje como herbicida para campos de secano y huertos. Los ejemplos de las malas hierbas de campos de secano pueden incluir malas hierbas de hoja ancha tales como malas hierbas de *Solanaceae* representadas por *Solanum nigrum* y *Datura stramonium*; malas hierbas de *Geraniaceae* representadas por *Granium carolinianum*; malas hierbas de *Malvaceae* representadas por *Abutilon theophrasti* y *Sida spinosa*; malas hierbas de *Convolvulaceae* representadas por *Ipomoea spp.* tales como *Ipomoea purpurea* y *Calystegia spp.*; malas hierbas de *Amaranthaceae* representadas por *Amaranthus lividus* y *Amaranthus retroflexus*; malas hierbas de *Compositae* representadas por *Xanthium pensilvanicum*, *Ambrosia artemisiaefolia*, *Helianthus annuus*, *Galinsoga ciliata*, *Cirsium arvense*, *Senecio vulgaris* y *Erigeron annuus*; malas hierbas de *Cruciferae* representadas por *Rorippa indica*, *Sinapis arvensis* y *Capsella Bursapastoris*; malas hierbas de *Poligonaceae* representadas por *Poligonum Blumei* y *Poligonum convolvulus*; malas hierbas de *Portulacaceae* representadas por *Portulaca oleracea*; malas hierbas de *Chenopodiaceae* representadas por *Chenopodium album*, *Chenopodium ficifolium* y *Kochia scoparia*; malas hierbas de *Caryophyllaceae* representadas por *Stellaria media*; malas hierbas de *Scrophulariaceae* representadas por *Veronica persica*; malas hierbas de *Commelinaceae* representadas por *Commelina communis*; malas hierbas de *Labiatae* representadas por *Lamium amplexicaule* y *Lamium purpureum*; malas hierbas de *Euphorbiaceae* representadas por *Euphorbia supina* y *Euphorbia maculata*; malas hierbas de *Rubiaceae* representadas por *Galium spurium* y *Rubia akane*; malas hierbas de *Violaceae* representadas por *Viola mandshurica*; malas hierbas de *Leguminosae* representadas por *Sesbania exaltata* y *Cassia obtusifolia*; y *Oxalidaceae* representadas por *Oxalis corniculata*; malas hierbas de *Graminaceous* representadas por *Sorghum bicolor*, *Panicum dichotomiflorum*, *Sorghum halepense*, *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, *Echinochloa crus-galli var. praticola*, *Echinochloa utilis*, *Digitaria ciliaris*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, y *Alopecurus aequalis*; y malas hierbas de *Cyperaceous* representadas por *Cyperus rotundus* y *Cyperus esculentus* y similares.

- El compuesto de la presente invención puede usarse en cualquier método de tratamiento de tratamiento al suelo, tratamiento de incorporación al suelo y tratamiento al follaje en tierras no agrícolas tales como céspedes, campos de juego, terrenos abiertos, arcenes de carreteras y arcenes de vías de ferrocarril distintos de campos agrícolas y hortícolas tales como arrozales, campos de secano y huertos. Como malas hierbas en estos terrenos no agrícolas, se ejemplifican los siguientes ejemplos de las malas hierbas además de las descritas como malas hierbas en campos de secano y huertos. Los ejemplos de las malas hierbas pueden incluir *Poa annua*, *Taraxacum officinale*, *Conyza sumatrensis*, *Cardamina flexuosa*, *Trifolium repens*, *Hydrocotyle sibthorpioides*, *Plantago asiatica*, *Cyperus brevifolius*, *Kyllinga brevifolia* y *Equisetum arvense* y similares.
- 5 Cuando el compuesto de la presente invención se aplica como herbicida, el compuesto se mezcla habitualmente con un portador líquido o portador sólido apropiado, y tensioactivos, agentes de penetración, agentes de diseminación, espesantes, agentes anticongelantes, aglutinantes, agentes antiapelmazamiento, agentes disgregantes, agentes estabilizantes y similares, si se desea. El herbicida puede aplicarse a usos prácticos mediante cualquier formulación de herbicida de la forma de herbicida tal como agentes dispersables en agua, agentes de emulsión, agentes que pueden fluir, agentes que pueden fluir en seco, agentes líquidos, agentes en polvo, agentes en gránulos o agentes en gel. Desde el punto de vista del ahorro de labor y mejora de la seguridad, cualquiera de la formulación de herbicida de la forma de herbicida puede aplicarse en un estado encapsulado en un envase soluble en agua.
- 10 Los ejemplos de los portadores sólidos pueden incluir minerales naturales tales como cuarzo, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita y tierra de diatomeas; sales inorgánicas tales como carbonato de calcio, sulfato de amonio, sulfato de sodio y cloruro de potasio; y ácido silícico sintético y silicatos sintéticos.
- 15 Los ejemplos de los portadores líquidos pueden incluir alcoholes tales como etilenglicol, propilenglicol e isopropanol; hidrocarburos aromáticos tales como xileno, alquilbenceno y alquilnaftaleno; éteres tales como butil Cellosolve; cetonas tales como ciclohexanona; ésteres tales como γ -butirolactona; amidas de ácido tales como N-metilpirrolidona y N-octilpirrolidona; aceites vegetales tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón y aceite de ricino; y agua.
- 20 Estos portadores sólidos y portadores líquidos pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.
- 25 Los ejemplos del tensioactivo pueden incluir tensioactivos no iónicos tales como alquil éteres de polioxietileno, alquilaril éteres de polioxietileno, estirilfenil éteres de polioxietileno, copolímeros de bloque de polioxietileno-polioxipropileno, ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos de sorbitano y ésteres de ácidos grasos de polioxietileno-sorbitano; tensioactivos aniónicos tales como sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno, sulfonatos de lignina, sulfosuccinatos de alquilo, sulfonato de naftaleno, sulfonatos de alquilnaftaleno, sales de condensado de formalina de ácido naftalenosulfónico, sales de condensado de formalina de ácido alquilnaftalenosulfónico, alquilaril éter sulfatos y fosfatos de polioxietileno, estirilfenil éter sulfatos y fosfatos de polioxietileno, policarboxilatos y sulfonatos de poliestireno; tensioactivos catiónicos tales como sales de alquilamina y sales alquilamonio cuaternario; y tensioactivos anfóteros tales como tensioactivos de tipo aminoácido y tensioactivos de tipo betaína.
- 30 El contenido de los tensioactivos no está particularmente limitado. Habitualmente, el contenido está preferiblemente en un intervalo de 0,05 partes en peso a 20 partes en peso en relación con 100 partes en peso de la formulación de herbicida de la presente invención. Estos tensioactivos pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos.
- 35 El compuesto de la presente invención puede aplicarse en un estado mezclado con otro herbicida, diversos insecticidas, un bactericida, un regulador del crecimiento de plantas, un sinergista, o similares en el momento de la formulación o aplicación del herbicida.
- 40 En particular, aplicando el herbicida en un estado mezclado con otro herbicida, puede esperarse una reducción del coste por una reducción en la cantidad de aplicación, una expansión en el espectro herbicida por la acción sinérgica de herbicidas mezclados y un efecto herbicida superior. En este momento, también es posible una combinación de una pluralidad de herbicidas conocidos al mismo tiempo.
- 45 Los ejemplos del herbicida preferible usado en una mezcla con el compuesto de la presente invención pueden incluir acetoclor / nombre general, acifluorfen / nombre general, aclonifen / nombre general, alaclor / nombre general, aloxidim / nombre general, aloxidim-sodio / nombre general, ametrina / nombre general, amicarbazona / nombre general, amidosulfurón / nombre general, aminociclopiraclor / nombre general, aminociclopiraclor-sales y ésteres, aminopirralid / nombre general, aminopirralid-sales y ésteres, amiprofos-metilo / nombre general, amitrol / nombre general, anilofos / nombre general, asulam / nombre general, atrazina / nombre general, azafenidina / nombre general, azimsulfurón / nombre general, beflubutamid / nombre general, benazolin-etilo / nombre general, bencarbazona / nombre general, benfluralina (benefin) / nombre general, benfuresato / nombre general, bensulfurón-metilo / nombre general, bensulida / nombre general, bentazona / nombre general, bentazona-sodio / nombre
- 50
- 55
- 60
- 65

general, bentazona-sales, bentiocarb / nombre general, benzfendizona / nombre general, benzobiciclón / nombre
 general, benzofenap / nombre general, bialafos / nombre general, bialafos-sodio / nombre general, biciclopirona /
 nombre general, bifenox / nombre general, bispiribac / nombre general, bispiribac-sodio / nombre general, bromacil /
 nombre general, bromobutida / nombre general, bromofenoxim / nombre general, bromoxinil / nombre general,
 5 bromoxinil-sales y ésteres, butaclor / nombre general, butafenacil / nombre general, butamifos / nombre general,
 butenaclor / nombre general, butralina / nombre general, butroxidim / nombre general, butilato / nombre general,
 cafenstrol / nombre general, carbetamida / nombre general, carfentrazona-etilo, clometoxifen / nombre general,
 clometoxinil / nombre general, cloramben / nombre general, cloramben-sales y ésteres, cloransulam-metilo / nombre
 general, clorflurenol-metilo / nombre general, cloridazona / nombre general, clorimurón-etilo / nombre general,
 10 clorobromurón / nombre general, clorotolurón / nombre general, cloroxurón / nombre general, clorftalim / nombre
 general, clorprofam / nombre general, clorprofam / nombre general, clorsulfurón / nombre general, clortal-dimetilo /
 nombre general, clortiamid / nombre general, cinidón-etilo / nombre general, cinmetilina / nombre general,
 cinosulfurón / nombre general, cletodim / nombre general, clodinafop / nombre general, clodinafop-propargilo /
 nombre general, clomazona / nombre general, clomeprop / nombre general, clopiralid / nombre general, clopiralid-
 sales y ésteres, CNP / nombre general, cumilurón / nombre general, cianazina / nombre general, cicloato / nombre
 general, ciclopirimorato / nombre general (SW-065/ nombre de prueba), ciclosulfamurón / nombre general, cicloxidim
 / nombre general, cihalofop-butilo / nombre general, DAH-500/ nombre de prueba, dalapon / nombre general,
 dazomet / nombre general, desmedifam / nombre general, desmetrina / nombre general, dicamba / nombre general,
 dicamba-sales y ésteres, diclobenil / nombre general, diclofop / nombre general, diclofop-metilo / nombre general,
 20 diclorprop / nombre general, diclorprop-sales y ésteres, diclorprop-P / nombre general, diclorprop-P-sales y ésteres,
 diclosulam / nombre general, difenzoquat / nombre general, diflufenican / nombre general, diflufenzopir / nombre
 general, diflufenzopir-sodio / nombre general, dimepiperato / nombre general, dimetametrina / nombre general,
 dimetaclor / nombre general, dimetenamid / nombre general, dimetenamid-p / nombre general, dimetipin / nombre
 general, dinitramina / nombre general, dinoseb / nombre general, dinoterb / nombre general, DNOC / nombre
 general, difenamid / nombre general, diquqt / nombre general, ditiopil / nombre general, diurón / nombre general,
 25 DSMA / nombre general, dimron / nombre general, endotal / nombre general, EPTC / nombre general, esprocarb /
 nombre general, etalfluralina / nombre general, etametsulfurón-metilo / nombre general, etofumesato / nombre
 general, etobenzanid / nombre general, etoxisulfurón / nombre general, flazasulfurón / nombre general, fenoxaprop
 / nombre general, fenoxaprop-etilo / nombre general, fenoxasulfona / nombre general, fenquionotrión / nombre
 general, fentrazamida / nombre general, flamprop / nombre general, flazasulfurón / nombre general, florasulam /
 nombre general, fluazifop / nombre general, fluazifop-butilo / nombre general, fluazolato / nombre general,
 30 flucarbazona-sodio / nombre general, flucetosulfurón / nombre general, flucloralina / nombre general, flufenacet /
 nombre general, flufenpil-etilo / nombre general, flumetsulam / nombre general, flumiclorac-pentilo / nombre general,
 flumioxazina / nombre general, fluometurón / nombre general, fluoroglicofen-etilo / nombre general, flupirsulfurón /
 nombre general, flupoxam / nombre general, fluorenol / nombre general, fluridona / nombre general, flurocloridona /
 nombre general, fluroxipir / nombre general, fluroxipir-ésteres, flurprimidol / nombre general, flurtamona / nombre
 general, flutiacet-metilo / nombre general, fomesafen / nombre general, foramsulfurón / nombre general, fosamina /
 nombre general, glufosinato / nombre general, glufosinato-amonio / nombre general, glifosato / nombre general,
 35 glifosato-amonio / nombre general, glifosato-iso-propilamonio / nombre general, glifosato-potasio / nombre general,
 glifosato-sodio / nombre general, glifosato-trimesio / nombre general, halauxifen / nombre general, halauxifen-sales y
 ésteres, halosafen / nombre general, halosulfurón / nombre general, halosulfurón-metilo / nombre general, haloxifop /
 nombre general, haloxifop-metilo / nombre general, hexazinona / nombre general, imazametabenz-metilo / nombre
 general, imazamox / nombre general, imazapic / nombre general, imazapir / nombre general, imazetapir / nombre
 general, imazaquin / nombre general, imazosulfurón / nombre general, indanofan / nombre general, indaziflam /
 nombre general, yodosulfurón-metil-sodio / nombre general, ioxinil octanoato / nombre general, ioxinil-sales y
 45 ésteres, ipfencarbazona / nombre general, isoproturón / nombre general, isourón / nombre general, isoxaben /
 nombre general, isoxaflutol / nombre general, karbutilato / nombre general, lactofen / nombre general, lenacil /
 nombre general, linurón / nombre general, hidrazida maleica / nombre general, MCPA / nombre general, MCPA-
 sales y ésteres, MCPB / nombre general, MCPB-sales y ésteres, mecoprop (MCPP) / nombre general, mecoprop-
 sales y ésteres, mecoprop-P (MCPP-P) / nombre general, mecoprop-P sales y ésteres, mefenacet / nombre general,
 50 mefluidida / nombre general, mesosulfurón-metilo / nombre general, mesotriona / nombre general, metam / nombre
 general, metamifop / nombre general, metamitrón / nombre general, metazaclor / nombre general, metabenztiaturón
 / nombre general, metazosulfurón / nombre general, metiozolina / nombre general, metilazida / nombre general,
 bromuro de metilo / nombre general, metilo dimron / nombre general, yoduro de metilo / nombre general,
 55 metobenzurón / nombre general, metolaclor / nombre general, metolaclor-S / nombre general, metosulam / nombre
 general, metribuzina / nombre general, metsulfurón-metilo / nombre general, metoxurón / nombre general, molinato /
 nombre general, monolinurón / nombre general, monosulfurón / nombre general, monosulfurón-metilo / nombre
 general, MSMA / nombre general, naproanilida / nombre general, napropamida / nombre general, naptalam / nombre
 general, naptalam-sodio / nombre general, neburón / nombre general, nicosulfurón / nombre general, norflurazón /
 nombre general, OK-701/ nombre de prueba, ácido oleico / nombre general, orbencarb / nombre general,
 60 ortosulfamurón / nombre general, orizalina / nombre general, oxadiargilo / nombre general, oxadiazón / nombre
 general, oxasulfurón / nombre general, oxaziclomefona / nombre general, oxifluorfen / nombre general, paraquat /
 nombre general, ácido pelargónico / nombre general, pendimetalina / nombre general, penoxsulam / nombre general,
 pentanoclor / nombre general, pentoxazona / nombre general, petoxamid / nombre general, fenmedifam-etilo /
 nombre general, picloram / nombre general, picloram-sales y ésteres, picolinafen / nombre general, pinoxaden /
 nombre general, piperofos / nombre general, pretilaclor / nombre general, primisulfurón-metilo / nombre general,

prodiamina / nombre general, profluazol / nombre general, profoxidim / nombre general, prometón / nombre general, prometrina / nombre general, propaclor / nombre general, propanil / nombre general, propaquizafop / nombre general, propazina / nombre general, profam / nombre general, propisoclor / nombre general, propoxicarbazona-sodio / nombre general, propirisulfurón / nombre general, propizamida / nombre general, prosulfocarb / nombre general, prosulfurón / nombre general, piraclonil / nombre general, piraflufen-etilo / nombre general, pirasulfotol / nombre general, pirazolinato / nombre general, pirazosulfurón / nombre general, pirazosulfurón-etilo / nombre general, pirazoxifen / nombre general, piribenzoxim / nombre general, piributicarb / nombre general, piridafol / nombre general, piridato / nombre general, piriftalid / nombre general, piriminobac-metilo / nombre general, pirimisulfán / nombre general, piritiobac-sodio / nombre general, piroxasulfona / nombre general, piroxsulam / nombre general, quinclorac / nombre general, quinmerac / nombre general, quinoclamina / nombre general, quizalofop / nombre general, quizalofop-etilo / nombre general, quizalofop-tefurilo / nombre general, quizalofop-P / nombre general, quizalofop-P-etilo / nombre general, quizalofop-P-tefurilo / nombre general, rimsulfurón / nombre general, saflufenacil / nombre general, setoxidim / nombre general, sidurón / nombre general, simazina / nombre general, simetrina / nombre general, SL-261 / nombre de prueba, sulcotriona / nombre general, sulfentrazona / nombre general, sulfometurón-metilo / nombre general, sulfosulfurón / nombre general, TCBA (2,3,6-TBA) / nombre general, 2,3,6-TBA-sales y ésteres, TCTP (clortal-dimetilo, tetraclorotiofeno) / nombre general, tebutam / nombre general, tebutiurón / nombre general, tefuriltriona / nombre general, tembotriona / nombre general, tepaloxidim / nombre general, terbacil / nombre general, terbumetón / nombre general, terbutilazina / nombre general, terbutrina / nombre general, tetrapión (flupropanato) / nombre general, tenilclor / nombre general, tiazaflurón / nombre general, tiazopir / nombre general, tidiazimin / nombre general, tidiazurón / nombre general, tiencarbazona-metilo / nombre general, tifensulfurón-metilo / nombre general, tolpiralato / nombre general, topramezón / nombre general, tralcoxidim / nombre general, triafamona / nombre general, trialato / nombre general, triasulfurón / nombre general, triaziflam / nombre general, tribenurón-metilo / nombre general, triclopir / nombre general, triclopir-sales y ésteres, tridifano / nombre general, trietazina / nombre general, trifludimoxadin / nombre general, trifloxisulfurón / nombre general, trifluralina / nombre general, triflusulfurón-metilo / nombre general, tritosulfurón / nombre general, 2,4-PA / nombre general, 2,4-PA-sales y ésteres, 2,4-DB / nombre general y 2,4-DB-sales y ésteres. Estos componentes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos. Cuando estos componentes se mezclan, la razón de mezclado puede seleccionarse libremente.

Los ejemplos de protectores pueden incluir AD-67, benoxacor / nombre general, cloquintocet-mexilo / nombre general, ciomerinil / nombre general, diclormid / nombre general, diclonona / nombre general, ciprosulfamida / nombre general, diorato / nombre general, DKA-24, dimron / nombre general, fenclorazol-etilo / nombre general, fenclorim / nombre general, HEXIM / nombre general, flurazol / nombre general, fluxofenim / nombre general, furilazol / nombre general, isoxadifen / nombre general, isoxadifen-etilo / nombre general, MCPA, mecoprop / nombre general, mefenpir / nombre general, mefenpir-etilo / nombre general, mefenpir-dietilo / nombre general, mefenato / nombre general, MG-191, NA (anhídrido naftálico), OM (octametileno-diamina), oxabetrinil / nombre general, PPG-1292 y R-29148. Estos componentes activos químicos agrícolas pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más de los mismos. Cuando se mezclan estos componentes, la razón de mezclado puede seleccionarse libremente.

Aunque la cantidad de aplicación del compuesto de la presente invención varía dependiendo de la situación de aplicación, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, el cultivo cultivado y similares, la cantidad de aplicación apropiada es generalmente de 0,005 kg/ha a 50 kg/ha como la cantidad del componente activo.

Seguidamente, se describirán los ejemplos de formulación de las formulaciones de herbicida cuando se usa el compuesto de la presente invención. Sin embargo, los ejemplos de formulación de la presente invención no se limitan a estos ejemplos. A continuación en el presente documento, el término "parte" en los ejemplos de formulación significa parte en peso.

Agente dispersable en agua

Compuesto de la presente invención	de 0,1 partes a 80 partes
Portador sólido	de 5 partes a 98,9 partes
Tensioactivo	de 1 parte a 10 partes
Otros	de 0 partes a 5 partes

Los ejemplos de otros pueden incluir agentes antiapelmazamiento, agentes estabilizantes y similares.

Agente de emulsión

Compuesto de la presente invención	de 0,1 partes a 30 partes
Portador líquido	de 45 partes a 95 partes

	Tensioactivo	de 4,9 partes a 15 partes
5	Otros	de 0 partes a 10 partes
	Los ejemplos de otros pueden incluir agentes de diseminación, agentes estabilizantes y similares.	
	Agente que puede fluir	
10	Compuesto de la presente invención	de 0,1 partes a 70 partes
	Portador líquido	de 15 partes a 98,89 partes
15	Tensioactivo	de 1 parte a 12 partes
	Otros	de 0,01 partes a 30 partes
	Los ejemplos de otros pueden incluir agentes anticongelantes, espesantes y similares.	
20	Agente que puede fluir en seco	
	Compuesto de la presente invención	de 0,1 partes a 90 partes
25	Portador sólido	de 0 partes a 98,9 partes
	Tensioactivo	de 1 parte a 20 partes
	Otros	de 0 partes a 10 partes
30	Los ejemplos de otros pueden incluir aglutinantes, agentes estabilizantes y similares.	
	Agente líquido	
35	Compuesto de la presente invención	de 0,01 partes a 70 partes
	Portador líquido	de 20 partes a 99,99 partes
	Otros	de 0 partes a 10 partes
40	Los ejemplos de otros pueden incluir agentes anticongelantes, agentes de diseminación y similares.	
	Agente en gránulos	
45	Compuesto de la presente invención	de 0,01 partes a 80 partes
	Portador sólido	de 10 partes a 99,99 partes
	Otros	de 0 partes a 10 partes
50	Los ejemplos de otros pueden incluir aglutinantes, agentes estabilizantes y similares.	
	Agente en polvo	
55	Compuesto de la presente invención	de 0,01 partes a 30 partes
	Portador sólido	de 65 partes a 99,99 partes
	Otros	de 0 partes a 10 partes
60	Los ejemplos de otros pueden incluir agentes antiamontonamiento, agentes estabilizantes y similares.	
	Cuando se usan los agentes, la formulación de herbicida se aplica sin ningún tratamiento o diluyendo el agente hasta de 1 a 10.000 veces con agua.	
65	Ejemplo de formulación de herbicida	

Seguidamente, se describirán ejemplos de la formulación química agrícola que contiene el compuesto de la presente invención como componente activo. Sin embargo, la presente invención no se limita a estos ejemplos. A continuación en el presente documento, el término "parte" en los ejemplos de formulación significa parte en peso.

5 Ejemplo de formulación 1. Agente dispersable en agua

Compuesto de la presente invención n.º 1-001 20 partes

Pirofilita 76 partes

10 Sorpol 5039 2 partes

(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)

15 CARPLEX n.º 80 2 partes

(ácido silícico hidratado sintético: Shionogi & Co., Ltd., nombre comercial)

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para dar el agente dispersable en agua.

20 Ejemplo de formulación 2. Agente de emulsión

Compuesto de la presente invención n.º 1-001 5 partes

25 Xileno 75 partes

N-metilpirrolidona 15 partes

30 Sorpol 2680 5 partes

(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)

Los componentes anteriores se mezclan para dar el agente de emulsión.

35 Ejemplo de formulación 3. Agente que puede fluir

Compuesto de la presente invención n.º 1-001 25 partes

Agrisol S-710 10 partes

40 (Tensioactivo no iónico: Kao Corporation, nombre comercial)

Lunox 1000C 0,5 partes

45 (Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)

Goma xantana 0,02 partes

50 Agua 64,48 partes

Tras mezclar uniformemente los componentes anteriores, se pulverizó en húmedo la mezcla para dar el agente que puede fluir.

55 Ejemplo de formulación 4. Agente que puede fluir en seco

Compuesto de la presente invención n.º 1-001 75 partes

HITENOL NE-15 5 partes

60 (Tensioactivo aniónico: fabricado por DKS Co. Ltd., nombre comercial)

Vanillex N 10 partes

(Tensioactivo aniónico: fabricado por NIPPON PAPER INDUSTRIES CO., LTD., nombre comercial)

65 CARPLEX n.º 80 10 partes

(ácido silícico hidratado sintético: Shionogi & Co., Ltd., nombre comercial)

5 Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan y luego se añadió una pequeña cantidad de agua a la mezcla para agitarla, mezclarla y amasarla. Se granuló la mezcla resultante con una granuladora de tipo extrusora. Los gránulos se secan para formar el agente que puede fluir en seco.

Ejemplo de formulación 5. Agente granular

10	Compuesto de la presente invención n.º 1-001	1 parte
	Bentonita	55 partes
15	Talco	44 partes

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan y luego se añadió una pequeña cantidad de agua a la mezcla para agitarla, mezclarla y amasarla. Se granuló la mezcla resultante con una granuladora de tipo extrusora. Los gránulos se secan para dar el agente granular.

20 Ejemplos

A continuación en el presente documento la presente invención se describirá adicionalmente en detalle describiendo específicamente ejemplos de síntesis y ejemplos de prueba de los compuestos de amida heterocíclicos de fórmula (1) en la presente invención como ejemplos. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos.

25 Como cromatografía de líquidos preparativa de presión media descrita en los ejemplos de síntesis y ejemplos de referencia, se usó un aparato preparativo de presión media; YFLC-Wprep (velocidad de flujo: 18 ml/min, columna rellena de gel de sílice de 40 µm) fabricado por Yamazen Corporation.

30 Se midieron los valores de desplazamiento químico de resonancia magnética nuclear de protón en los ejemplos a 300 MHz usando Me₄Si (tetrametilsilano) como sustancia de referencia. Los disolventes usados en la medición se describen en los ejemplos de síntesis a continuación. Los símbolos de los valores de desplazamiento químico de la resonancia magnética nuclear de protón en los ejemplos tienen los siguientes significados.

35 s: singlete, d: doblete, t: triplete, m: multiplete, q: cuartete y a: ancho

Ejemplos de síntesis

Ejemplo de síntesis 1

40 3-Isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-003)

Etapas 1; Síntesis de 2-hidrazinil-6-metilnicotinato de metilo

45 A la disolución mezclada de 3,0 g (16,2 mmol) de 2-cloro-6-metilnicotinato de metilo y 30 ml de dioxano, se le añadieron 1,62 g (32,3 mmol) de hidrazina monohidratada a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción a 60°C durante 4 horas y posteriormente 80°C durante 6 horas. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (150 ml, 2 veces). Se lavó la fase orgánica obtenida con una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. Después

50 de eso, se deshidrató la fase orgánica y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con hexano y se filtró para dar 1,60 g del producto objetivo como un sólido naranja.

Punto de fusión: de 90°C a 91°C.

55 Etapas 2; Síntesis de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-metilnicotinato de metilo

A la disolución mezclada de 1,5 g (8,28 mmol) de 2-hidrazinil-6-metilnicotinato de metilo, 838 mg (8,28 mmol) de trietilamina y 20 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 882 mg (8,28 mmol) de cloruro de isobutirilo bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (100 ml, 1 vez). Se lavó la fase orgánica obtenida con agua. Después de eso, se deshidrató la fase orgánica y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con hexano y diisopropil éter y se filtró para dar 1,68 g del producto objetivo como un sólido de color carne.

65

Punto de fusión: de 99°C a 101°C.

Etapa 3; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

5 A la disolución mezclada de 1,6 g (63,7 mmol) de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-metilnicotinato de metilo y 10 ml de tolueno, se le añadieron 3 ml de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 5 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la agitación, se añadió la mezcla de reacción a hielo-agua para terminar la reacción. Después de eso, se lavó el líquido de reacción con acetato de etilo (50 ml, 1 vez). A la fase acuosa obtenida, se le añadió carbonato de potasio bajo enfriamiento con hielo para ajustar el pH a de 8 a 9. Después de eso, se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (100 ml, 2 veces). Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 490 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo claro.

15 Punto de fusión: de 138°C a 140°C.

Etapa 4; Síntesis de ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

20 A la disolución mezclada de 450 mg (1,93 mmol) de 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 4 ml de metanol, se le añadieron 2 ml de disolución acuosa de hidróxido de sodio 1 M a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH a de 2 a 3. Tras eliminarse por destilación el disolvente en el líquido de reacción a presión reducida, se lavó el sólido precipitado con agua y se filtró para dar 250 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo claro.

Punto de fusión: de 194°C a 195°C.

Etapa 5; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida

30 A un disolvente mezclado de 400 mg (1,95 mmol) de ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 0,1 ml de N,N-dimetilformamida y 3 ml de cloruro de metileno, se le añadieron 463 mg (3,91 mmol) de cloruro de oxalilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se eliminó por destilación el disolvente en la mezcla de reacción a presión reducida para dar clorhidrato de cloruro de ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico en bruto. A la disolución mezclada de 540 mg (1,95 mmol) del clorhidrato de cloruro de ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico en bruto obtenido, 180 mg (1,82 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 5 ml de cloruro de metileno, se le añadieron 368 mg (3,91 mmol) de trietilamina bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 20 horas a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se añadieron 5 ml de piridina y 10 mg de 4-(dimetilamino)piridina a la mezcla de reacción. Después de eso, se agitó la mezcla de reacción resultante a 60°C durante 10 horas. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (20 ml, 1 vez). Se lavó la fase orgánica obtenida con agua. Después de eso, se deshidrató la fase orgánica y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y acetato de etilo y se filtró para dar 60 mg del producto objetivo como un sólido marrón.

Ejemplo de síntesis 2

50 3-Isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-004)

A la disolución mezclada de 160 mg (0,59 mmol) de ácido 3-isopropil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 70 mg (0,71 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 5 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 135 mg (0,71 mmol) de clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida y 96 mg (0,71 mmol) de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 24 horas a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con cloroformo (100 ml, 1 vez). Se lavó la fase orgánica obtenida con agua. Después de eso, se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con cromatografía de gel de sílice {n-hexano:acetato de etilo = de 1:1 a 0:1 (razón en volumen; lo mismo se aplica a continuación)} para dar 90 mg del producto objetivo como un sólido blanco.

Punto de fusión: de 176°C a 178°C.

65 Ejemplo de síntesis 3

3-Isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-009)

5 Etapa 1; Síntesis de 2-hidrazinil-6-cloronicotinato de metilo

5 A la disolución mezclada de 11,5 g (55,8 mmol) de 2,6-dicloronicotinato de metilo y 150 ml de dioxano, se le añadieron 5,58 g (111 mmol) de hidrazina monohidratada a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 18 horas a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se eliminó por destilación el disolvente en el líquido de reacción a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con agua y se filtró para dar 10,7 g del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 82°C a 83°C.

15 Etapa 2; Síntesis de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-cloronicotinato de metilo

20 A la disolución mezclada de 5,0 g (24,8 mmol) de 2-hidrazinil-6-cloronicotinato de metilo, 2,5 g (24,8 mmol) de trietilamina y 20 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 2,64 g (24,8 mmol) de cloruro de isobutirilo bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (150 ml, 1 vez). Se lavó la fase orgánica obtenida con agua. Después de eso, se deshidrató la fase orgánica y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y hexano y se filtró para dar 5,90 g del producto objetivo como un sólido blanco.

25 Punto de fusión: de 147°C a 148°C.

Etapa 3; Síntesis de 3-isopropil-5-cloro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

30 Se mezclaron 5,9 g (21,7 mmol) de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-cloronicotinato de metilo y 20 ml de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente y después de eso se agitó la mezcla de reacción durante 5 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la agitación, se añadió la mezcla de reacción a hielo-agua para terminar la reacción. Después de eso, se lavó el líquido de reacción con acetato de etilo (50 ml, 1 vez). Se añadió carbonato de potasio a la fase acuosa obtenida bajo enfriamiento con hielo para ajustar el pH a de 8 a 9 y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (200 ml, 2 veces). Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 4,75 g del producto objetivo como un sólido de color parduzco-amarillo claro.

40 Punto de fusión: de 105°C a 107°C.

40 Etapa 4; Síntesis de 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

45 A la disolución mezclada de 420 mg (1,66 mmol) de 3-isopropil-5-cloro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 3 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 140 mg (1,99 mmol) de tiometóxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 45 minutos bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (30 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 280 mg del producto objetivo como un sólido marrón.

50 Punto de fusión: de 142°C a 145°C.

55 Etapa 5; Síntesis de 3-isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida

60 A la disolución mezclada de 140 mg (0,53 mmol) de 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo, 3 ml de metanol y 1 ml de agua, se le añadieron 0,6 ml de disolución acuosa de hidróxido de sodio 1 M a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 17 horas a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo 1 ml de ácido clorhídrico 1 M. Se eliminó por destilación el disolvente en el líquido de reacción a presión reducida para dar ácido 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico en bruto. A la disolución mezclada de 190 mg (0,53 mmol) del ácido 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico en bruto obtenido, 104 mg (1,06 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 3 ml de piridina, se le añadieron 126 mg (1,06 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción a 60°C durante 5 horas. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y cloroformo y se filtró para dar 57 mg del

producto objetivo como un sólido ocre.

Ejemplo de síntesis 4

5 3-Cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-013)

Etapa 1; Síntesis de ácido 3-cloro-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

10 A la disolución mezclada de 300 mg (1,30 mmol) de ácido 5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico y 6 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 347 mg (2,60 mmol) de N-clorosuccinimida a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción a 60°C durante 4 horas. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (50 ml, 2 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 210 mg del producto objetivo como un sólido marrón.

Etapa 2; Síntesis de 3-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida

20 A la disolución mezclada de 70 mg (0,26 mmol) de ácido 3-cloro-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 52 mg (0,53 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 10 mg (0,03 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina y 5 ml de piridina, se le añadieron 63 mg (0,53 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con cloroformo (15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 52 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo pálido.

30 Punto de fusión: de 238°C a 241°C.

Ejemplo de síntesis 5

35 3-Isopropil-N-(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 3-001)

A la disolución mezclada de 165 mg (0,60 mmol) de ácido 3-isopropil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 0,1 ml de N,N-dimetilformamida y 5 ml de cloruro de metileno, se le añadieron 83 mg (0,66 mmol) de cloruro de oxalilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 20 minutos a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se añadió la disolución mezclada de 119 mg (1,21 mmol) de 4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-amina, 122 mg (1,21 mmol) de trietilamina y 3 ml de cloruro de metileno. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con cromatografía de gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = de 9:1 a 2:1) para dar 168 mg del producto objetivo como un sólido blanco.

Punto de fusión: de 185°C a 186°C.

Ejemplo de síntesis 6

50 5-Cloro-3-isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 2-004)

A la disolución mezclada de 500 mg (1,97 mmol) de 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo, 3 ml de metanol y 1 ml de agua, se le añadieron 2 ml de disolución acuosa de hidróxido de sodio 1 M bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo 2,5 ml de ácido clorhídrico 1 M. Se eliminó por destilación el disolvente en el líquido de reacción a presión reducida para dar ácido 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico en bruto. A la disolución mezclada de 500 mg (1,97 mmol) del ácido 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico en bruto obtenido, 390 mg (3,94 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina, 24 mg (0,19 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina y 5 ml de piridina, se le añadieron 469 mg (3,94 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 2 días a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se terminó la reacción añadiendo agua y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (50 ml, 2 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con cromatografía de gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = de 4:1 a 1:1) para dar 140 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo claro.

Punto de fusión: de 189°C a 190°C.

Ejemplo de síntesis 7

3-(Metoximetil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 2-010)

Etapa 1; Síntesis de 2-(2-(2-metoxiacetil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo (compuesto n.º A1-05a)

A la disolución mezclada de 1,0 g (4,25 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo, 473 mg (4,68 mmol) de trietilamina y 20 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 2 ml de disolución en tetrahidrofurano de 508 mg (4,68 mmol) de cloruro de metoxiacetilo bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Tras añadirse 15 ml de agua, se extrajo la mezcla con cloroformo (30 ml, 1 vez y 10 ml, 2 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 1,16 g del producto objetivo como un sólido blanco.

Punto de fusión: de 76°C a 77°C.

Etapa 2; Síntesis de 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo (compuesto n.º B1-05a)

A la disolución mezclada de 1,16 g (3,78 mmol) de 2-(2-(2-metoxiacetil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo y 17 ml de tolueno, se le añadieron 1,74 g (11,3 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 5 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la reacción, se vertió la disolución de reacción en 20 ml de agua preparada por separado. Se añadió una disolución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio para ajustar el pH a de 8 a 9 y después de eso se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica combinada y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 721 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 95°C a 97°C.

Etapa 3; Síntesis de ácido 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico (compuesto n.º C1-05)

A la disolución mezclada de 693 mg (2,39 mmol) de 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 7 ml de etanol, se le añadieron 7 ml de disolución acuosa de 115 mg (2,87 mmol) de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la reacción, se añadió ácido clorhídrico 1 M a la disolución de reacción para ajustar el pH a de 2 a 3. Después de eso, se extrajo la mezcla resultante con cloroformo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 553 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 111°C a 112°C.

Etapa 4; Síntesis de 3-(metoximetil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida

A la disolución mezclada de 100 mg (0,36 mmol) de ácido 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 72 mg (0,73 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina, 5 mg de 4-dimetilaminopiridina y 2 ml de piridina, se le añadieron 87 mg (0,73 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción a temperatura ambiente durante 30 minutos. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Al residuo obtenido, se le añadió ácido clorhídrico 1 mol/l para ajustar el pH a de 2 a 3. Después de eso, se extrajo la mezcla resultante con cloroformo (15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 76 mg del producto objetivo como un sólido blanco.

Punto de fusión: de 205°C a 209°C.

Ejemplo de síntesis 8

5 N-(5-Metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-018)

Etapa 1; Síntesis de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

10 Se agitó la disolución mezclada de 1,0 g (4,25 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo, 795 mg (4,46 mmol) de 1,1'-tiocarbonildiimidazol y 10 ml de N,N-dimetilformamida a 60°C durante 3 horas. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 534 mg de la mezcla del producto objetivo e imidazol como un sólido rojo.

15 Etapa 2; Síntesis de 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

20 A 10 ml de disolución en N,N-dimetilformamida de 534 mg de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo obtenido en la etapa 1 que contiene imidazol, se le añadieron 402 mg de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción a temperatura ambiente durante 1,5 horas. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Se añadieron 15 ml de agua al residuo obtenido y se extrajo la mezcla resultante con cloroformo (15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 336 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 163°C a 167°C.

30 Etapa 3; Síntesis de ácido 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

35 A la disolución mezclada de 332 mg (1,14 mmol) de 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 3 ml de metanol, se le añadieron 2,8 ml (1,4 mmol) de disolución acuosa de hidróxido de sodio 0,5 mol/l bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 1 hora bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la reacción, se añadió ácido clorhídrico 1 mol/l a la disolución de reacción para ajustar el pH a de 2 a 3. Se lavó el sólido precipitado con ácido clorhídrico 1 mol/l, agua y diisopropil éter y se filtró para dar 228 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 158°C a 162°C.

40 Etapa 4; Síntesis de N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida

45 A la disolución mezclada de 100 mg (0,36 mmol) de ácido 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 71 mg (0,72 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 4 mg de 4-dimetilaminopiridina y 2 ml de piridina, se le añadieron 129 mg (1,08 mmol) de cloruro de tionilo bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción a temperatura ambiente durante 20 minutos. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Al residuo obtenido, se le añadió ácido clorhídrico 1 mol/l para ajustar el pH a de 2 a 3. Después de eso, se extrajo la mezcla resultante con cloroformo (15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 100 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

55 Punto de fusión: de 230°C a 233°C

Ejemplo de síntesis 9

60 3-Isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carbotioamida (compuesto n.º 2-039)

65 Se agitó la disolución mezclada de 100 mg (0,28 mmol) de 3-isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida, 114 mg (0,28 mmol) de reactivo de Lawesson [2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro] y 3 ml de tolueno a 110°C durante 5 horas. Tras la finalización de la agitación, se añadieron 114 mg (0,28 mmol) de reactivo de Lawesson a la disolución de reacción y se agitó adicionalmente la disolución resultante a 110°C durante 3 horas. Tras la finalización de la reacción, se añadieron 5 ml de ácido

clorhídrico 0,1 N a la disolución de reacción y se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (15 ml, 1 vez). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo (gradiente desde 4:1 hasta 3:7) para dar 66 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 198°C a 200°C

Ejemplo de síntesis 10

3-Alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida y N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-159 y compuesto n.º 1-159*)

Etapa 1; Síntesis de 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

A la disolución mezclada de 1,20 g (3,96 mmol) de 2-(2-(but-3-enoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo sintetizado en un método similar a la etapa 1 en el ejemplo de síntesis 7 y 18 ml de tolueno, se le añadieron 1,82 g (11,9 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 5 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la reacción, se vertió la disolución de reacción en 20 ml de agua preparada por separado. Se añadió una disolución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio para ajustar el pH a de 8 a 9 y después de eso se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica combinada y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo (gradiente desde 7:3 hasta 0:1) para dar 730 mg del producto objetivo como un sólido blanco [3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo/3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo = 4/1].

¹H-RMN de 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7,97 (d, 1H, J = 7,2Hz), 7,44 (d, 1H, J = 7,2Hz), 6,31-6,20 (m, 1H), 5,26-5,12 (m, 2H), 4,10 (s, 3H), 4,00 (dd, 2H, J = 6,3Hz, 1,2Hz).

¹H-RMN de 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7,94 (d, 1H, J=6,0Hz), 7,42 (d, 1H, J=6,0Hz), 7,00-6,90 (m, 1H), 6,66-6,58 (m, 1H), 4,10 (s, 3H), 2,04 (dd, 3H, J=6,6Hz, 1,8Hz).

Punto de fusión: de 121°C a 123°C.

Etapa 2; Síntesis de ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

A la disolución mezclada de 720 mg (2,65 mmol) de la mezcla de 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 10 ml de etanol, se le añadieron 7,0 ml (3,5 mmol) de disolución acuosa de hidróxido de sodio 0,5 mol/l bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la reacción, se añadió ácido clorhídrico 1 M a la disolución de reacción para ajustar el pH a de 2 a 3. Después de eso, se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (15 ml, 2 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida para dar 467 mg del producto objetivo como un sólido blanco [ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico/ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico = 4/1].

¹H-RMN de ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8,25 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,61 (d, 1H, 7,5Hz), 6,34-6,20 (m, 1H), 5,35-5,22 (m, 2H), 4,00 (dd, 2H, J=6,3Hz, 1,2Hz). (El pico de protón de CO₂H no se observó).

¹H-RMN de ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8,22 (d, 1H, J=8,1Hz), 7,58 (d, 1H, J=8,1Hz), 7,12-7,00 (m, 1H), 6,67-6,60 (m, 1H), 2,07 (dd, 3H, J=6,9Hz, 1,8Hz). (El pico de protón de CO₂H no se observó).

Punto de fusión: de 103°C a 104°C.

Etapa 3; Síntesis de 3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida y N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida

A la disolución mezclada de 100 mg (0,37 mmol) de la mezcla de ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, 55 mg (0,55 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 5 mg (0,04 mmol) de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol y 2 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 106 mg (0,55 mmol) de clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras la finalización de la agitación, se añadieron 3 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l y se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (10 ml, 2 veces). Se lavó la fase orgánica obtenida con agua. Después de eso, se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el sólido obtenido mediante recristalización en acetato de etilo para dar 67 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo claro.

[3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida/N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida = 4/1].

¹H-RMN de 3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12,9 (sa, 1H), 8,42 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,63 (d, 1H, J=7,5Hz), 6,38-6,24 (m, 1H), 5,36-5,23 (m, 2H), 4,03 (dd, 2H, J=6,9Hz, 1,2Hz), 2,59 (s, 3H).

¹H-RMN de N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12,9 (sa, 1H), 8,38 (d, 1H, J=6,9Hz), 7,60 (d, 1H, J=6,9Hz), 7,12-7,00 (m, 1H), 6,69-6,62 (m, 1H), 2,60 (s, 3H), 2,09 (dd, 3H, J=6,6Hz, 1,8Hz).

Punto de fusión: de 159°C a 161°C.

Ejemplo de síntesis 11

3-Alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida y N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 2-105 y compuesto n.º 2-105*)

A la disolución mezclada de 100 mg (0,37 mmol) de la mezcla de ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico sintetizados en la etapa 2 del ejemplo de síntesis 7, 56 mg (0,57 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina y 2 ml de piridina, se le añadieron 66 mg (0,55 mmol) de cloruro de tionilo a una temperatura de 15°C o menos. Tras la finalización de la adición, se mantuvo la temperatura de la disolución de reacción a 15°C o menos y se agitó durante 1,5 horas. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Al residuo obtenido, se le añadieron 1,5 ml de acetonitrilo y 2 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l y se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (10 ml, 2 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con acetato de etilo y se filtró para dar 27 mg del producto objetivo como un sólido de color marrón claro.

[3-alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida/N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida = 3/1].

¹H-RMN de 3-alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12,5 (sa, 1H), 8,40 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,65 (d, 1H, J=7,5Hz), 6,37-6,24 (m, 1H), 5,37-5,24 (m, 2H), 4,13 (s, 3H), 4,06 (dd, 2H, J=6,6Hz, 1,2Hz).

¹H-RMN de N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 12,5 (sa, 1H), 8,36 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,62 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,13-7,01 (m, 1H), 6,70-6,62 (m, 1H), 4,13 (s, 3H), 2,10 (dd, 3H, J=6,6Hz, 1,5Hz).

Punto de fusión: de 164°C a 167°C.

Ejemplo de síntesis 12

3-(2,2-Dicloro-1-metilciclopropil)-N-etil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida (compuesto n.º 1-174)

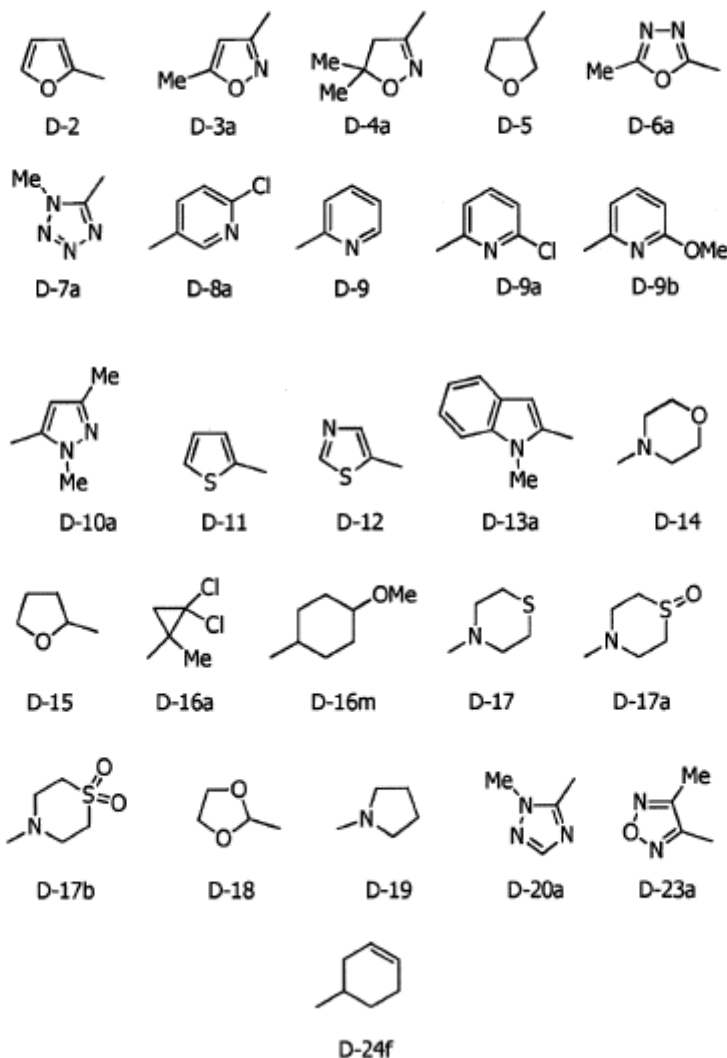
A 1 ml de una disolución en N,N-dimetilformamida de 67 mg de 3-(2,2-dicloro-1-metilciclopropil)-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida, se le añadieron 31 mg de carbonato de potasio y 48 mg de yoduro de etilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción a 55°C durante 30 minutos. Tras la finalización de la reacción, se añadieron 2 ml de agua y se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (3 ml, 2 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con

disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de magnesio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo (gradiente desde 2:1 hasta 0:1) para dar 21 mg del producto objetivo como una sustancia resinosa incolora.

$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7,72 (d, 1H, $J=7,8\text{Hz}$), 7,53 (d, 1H, $J=7,8\text{Hz}$), 4,15 (q, 2H, $J=7,2\text{Hz}$), 2,78 (d, 1H, $J=7,8\text{Hz}$), 2,38 (s, 3H), 1,83 (d, 1H, $J=7,8\text{Hz}$), 1,80 (s, 3H), 1,43 (t, 3H, $J=7,2\text{Hz}$).

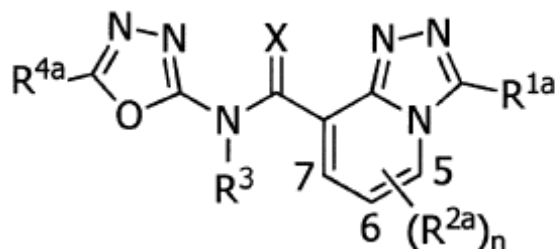
El compuesto de la presente invención puede sintetizarse según los ejemplos de síntesis descritos anteriormente. Los ejemplos de los compuestos de la presente invención producidos en métodos similares a del ejemplo de síntesis 1 al ejemplo de síntesis 9 se enumeran en la cuarta tabla a la décima tabla. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos. En las tablas, Me es grupo metilo. De manera similar, Et es grupo etilo, Pr es grupo propilo, Pen es grupo pentilo, Hex es grupo hexilo, Ph es grupo fenilo, Bn es grupo bencilo, i- es iso, c- es ciclo y t- es terciario.

Los sustituyentes de D-2, D-3a, D-4a, D-5, D-6a, D-7a, D-8a, D-9, D-9a, D-9b, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-15, D-16a, D-16m, D-17, D-17a, D-17b, D-18, D-19, D-20a, D-23a y D-24f en las tablas son las siguientes estructuras.



En las tablas, “*1” es “resinoso”. “*2” significa que se observó descomposición en el momento de la medición del punto de fusión. “*3” es una mezcla de los compuestos 1-158 y 1-158* de la presente invención que son isómeros que tienen diferentes estructuras y la razón de los mismos 1-158/1-158* es igual a 9/1. Tal como se describe en el ejemplo de síntesis 10, “*4” es la mezcla de los compuestos 1-159 y 1-159* de la presente invención que son isómeros que tienen diferentes estructuras y la razón de los mismos 1-159/1-159* es igual a 4/1. Tal como se describe en el ejemplo de síntesis 11, “*5” es la mezcla de los compuestos 2-105 y 2-105* de la presente invención que son isómeros que tienen diferentes estructuras y la razón de los mismos 2-105/2-105* es igual a 3/1.

Cuarta tabla



5 Tabla 27

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-001	H	5-CF ₃	O	H	Me	220-223
1-002	Me	5-CF ₃	O	H	Me	242-245
1-003	i-Pr	5-Me	O	H	Me	*2
1-004	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	176-178
1-005	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Et	176-180
1-006	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Bn	141-150
1-007	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Ph	173-177
1-008	i-Pr	5-CF ₃	O	H	D-2	152-156
1-009	i-Pr	5-SMe	O	H	Me	*2
1-010	c-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	157-165
1-011	3-Pen	5-CF ₃	O	H	Me	171-174
1-012	Ph	5-CF ₃	O	H	Me	266-270
1-013	Cl	5-CF ₃	O	H	Me	238-241
1-014	Br	5-CF ₃	O	H	Me	252-260
1-015	CH ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	115-125
1-016	4-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	205-208
1-017	4-Cl-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	256-258
1-018	SMe	5-CF ₃	O	H	Me	230-233
1-019	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	90-91
1-020	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	148-149
1-021	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	160-162
1-022	D-3a	5-CF ₃	O	H	Me	218-221
1-023	i-Pr	6-CF ₃	O	H	Me	160-162
1-024	n-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	172-176
1-025	CH ₂ OPh	5-CF ₃	O	H	Me	188-190
1-026	c-Pen	5-CF ₃	O	H	Me	170-171
1-027	CH ₂ OEt	5-CF ₃	O	H	Me	141-143
1-028	tBu	5-CF ₃	O	H	Me	161-165
1-029	D-4a	5-CF ₃	O	H	Me	172-176
1-030	CH ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	Me	153-155
1-031	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	162-163
1-032	SEt	5-CF ₃	O	H	Me	182-184
1-033	SCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	186-188
1-034	S(O)Et	5-CF ₃	O	H	Me	192-193
1-035	S(O)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	153-157
1-036	CH ₂ S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	190-191
1-037	CH ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	*1
1-038	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	200-202
1-039	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	*1
1-040	S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	*1
1-041	S(O) ₂ Et	5-CF ₃	O	H	Me	*1
1-042	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	O	H	Me	187-189
1-043	4-Me-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	221-223
1-044	4-F-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	203-208
1-045	4-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	O	H	Me	196-198
1-046	3-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	178-182
1-047	2-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	180-185
1-048	CH ₂ C(O)OH	5-CF ₃	O	H	Me	139-141

Tabla 28

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-049	CH ₂ C(O)OCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	157-159
1-050	i-Pr	5-CF ₃	O	H	H	171-175
1-051	i-Pr	5-CF ₃	O	H	c-Pr	161-162
1-052	i-Pr	5-CF ₃	O	H	(CH ₂) ₂ OMe	125-135
1-053	i-Pr	5-CF ₂ H	O	H	Me	160-162
1-054	D-8a	5-CF ₃	O	H	Me	240-243
1-055	D-9a	5-CF ₃	O	H	Me	205-208
1-056	D-10a	5-CF ₃	O	H	Me	274-275
1-057	D-11	5-CF ₃	O	H	Me	222-224
1-058	D-12	5-CF ₃	O	H	Me	213-216
1-059	D-13a	5-CF ₃	O	H	Me	272-274
1-060	CH ₂ C(O)O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	152-153
1-061	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	222-227
1-062	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	165-167
1-063	S(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	99-101
1-064	SCH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	213-217
1-065	SCH ₂ C≡CH	5-CF ₃	O	H	Me	114-117
1-066	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	O	H	Me	193-195
1-067	CH ₂ OH	5-CF ₃	O	H	Me	236-238
1-068	CHO	5-CF ₃	O	H	Me	222-223
1-069	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	172-174
1-070	3,5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	O	H	Me	228-229
1-071	3,5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	O	H	Me	254-256
1-072	CH=NOMe	5-CF ₃	O	H	Me	204-207
1-073	S(O)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	199-201
1-074	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	134-137
1-075	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	O	H	Me	168-169
1-076	NMe ₂	5-CF ₃	O	H	Me	184-185
1-077	S(O)CH ₂ C=CH	5-CF ₃	O	H	Me	205-212
1-078	CH(Me)SMe	5-CF ₃	O	H	Me	137-139
1-079	CH(Me)S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	127-129
1-080	CH(Me)S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	159-160
1-081	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	131-133
1-082	NHPh	5-CF ₃	O	H	Me	179-182
1-083	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	Me	157-159
1-084	(CH ₂) ₂ S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	179-181
1-085	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	191-192
1-086	N(Me)ph	5-CF ₃	O	H	Me	175-178
1-087	S(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	141-142
1-088	i-Pr	5-[3,5-(F) ₂ -Ph]	O	H	Me	191-193
1-089	i-Pr	5-CF ₃ -7-Me	O	H	Me	120-124
1-090	NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	163-164
1-091	SCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	H	211-213
1-092	S(O)(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	193-195
1-093	SCH ₂ CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	143-145
1-094	SCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	150-153
1-095	SC(CH ₃) ₃	5-CF ₃	O	H	Me	178-180
1-096	D-14	5-CF ₃	O	H	Me	166-168

5 Tabla 29

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-097	i-Pr	5-CF ₃	O	H	D-15	108-111
1-098	i-Pr	5-CF ₃	O	H	D-14	*1
1-099	i-Pr	5-CF ₃	O	H	4-MeO-Ph	154-158
1-100	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CF ₃	111-116
1-101	i-Pr	5-CF ₃	O	H	D-9	167-169
1-102	NH(D-9b)	5-CF ₃	O	H	Me	219-221
1-103	NMe ₂	5-CF ₃	O	H	H	200-205
1-104	CH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	O	H	Me	160-163

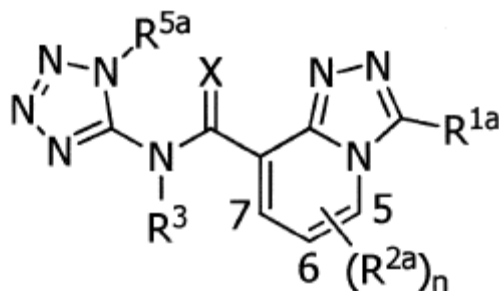
1-105	D-16a	5-CF ₃	O	H	Me	232-235
1-106	SEt	5-CF ₃	O	H	H	189-191
1-107	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	H	117-118
1-108	S(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	H	198-200
1-109	NH(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	150-155
1-110	D-14	5-CF ₃	O	H	H	180-182
1-111	NHS(O) ₂ Ph	5-CF ₃	O	H	Me	259-261
1-112	OEt	5-CF ₃	O	H	H	135-145
1-113	SCH ₂ Ph	5-CF ₃	O	H	Me	187-190
1-114	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	155-158
1-115	SCH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	O	H	Me	135-137
1-116	SCH ₂ (D-15)	5-CF ₃	O	H	Me	142-143
1-117	SCH ₂ CN	5-CF ₃	O	H	Me	179-182
1-118	D-17	5-CF ₃	O	H	Me	*1
1-119	D-17a	5-CF ₃	O	H	Me	250-255
1-120	D-17b	5-CF ₃	O	H	Me	235-238
1-121	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	H	131-134
1-122	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	H	155-157
1-123	N(Me)(c-Hex)	5-CF ₃	O	H	H	64-66
1-124	SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	156-157
1-125	SCH ₂ C(O)CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	178-182
1-126	SCH ₂ (D-18)	5-CF ₃	O	H	Me	200-203
1-127	SCH ₂ C(O)OMe	5-CF ₃	O	H	Me	184-185
1-128	SCH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	H	188-190
1-129	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	75-80
1-130	NH(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	Me	111-115
1-131	NHCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	140-144
1-132	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	164-168
1-133	N(Me)(c-Hex)	5-CF ₃	O	H	Me	135-140
1-134	N(Me)Et	5-CF ₃	O	H	Me	125-128
1-135	N(Et) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	135-137
1-136	D-19	5-CF ₃	O	H	Me	151-152
1-137	N(Me)Et	5-CF ₃	O	H	H	141-143
1-138	N(Et) ₂	5-CF ₃	O	H	H	130-131
1-139	D-19	5-CF ₃	O	H	H	217-218
1-140	i-Pr	5-CF ₃	O	H	D-11	200-201
1-141	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ SMe	114-116
1-142	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ S(O) ₂ Me	171-173
1-143	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ S(O)Me	149-150
1-144	c-Pr	5-CF ₃	O	H	H	170-174

Tabla 30]

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4a}	Punto de fusión(°C)
1-145	3-Pen	5-CF ₃	O	H	H	228-231
1-146	CH ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	H	176-179
1-147	4-F-Ph	5-CF ₃	O	H	H	222-226
1-148	3,5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	O	H	H	217-220
1-149	4-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	H	210-213
1-150	D-8a	5-CF ₃	O	H	H	244-248
1-151	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	H	187-190
1-152	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	O	H	Me	161-163
1-153	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	O	H	Me	138-143
1-154	S(c-Pen)	5-CF ₃	O	H	Me	153-155
1-155	S(c-Pen)	5-CF ₃	O	H	H	214-216
1-156	SCH ₂ (D-8a)	5-CF ₃	O	H	Me	171-172
1-157	SCH ₂ (D-8a)	5-CF ₃	O	H	H	204-207
1-158	CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	H	155-158(*3)
1-158*	CH=CHMe	5-CF ₃	O	H	H	155-158(*3)
1-159	CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	159-161(*4)
1-159*	CH=CHMe	5-CF ₃	O	H	Me	159-161(*4)
1-160	C≡CMe	5-CF ₃	O	H	H	*2
1-161	C≡CMe	5-CF ₃	O	H	Me	>280
1-162	CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	199-203
1-163	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	O	H	H	216-218
1-164	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	O	H	H	105-110
1-165	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	136-139

1-166	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	127-129
1-167	N(Me)CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	191-194
1-168	CH ₂ CN	5-CF ₃	O	H	Me	196-199
1-169	D-16m	5-CF ₃	O	H	Me	146-147
1-170	D-24f	5-CF ₃	O	H	Me	182-185
1-171	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	H	180-185
1-172	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	H	135-137
1-173	(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	157-158
1-174	D-16a	5-CF ₃	O	Et	Me	*1

Quinta tabla



5

Tabla 31

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-001	H	5-CF ₃	O	H	Me	247-251
2-002	Me	5-CF ₃	O	H	Me	215-219
2-003	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	215-220
2-004	i-Pr	5-Cl	O	H	Me	189-190
2-005	c-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	190-195
2-006	3-Pen	5-CF ₃	O	H	Me	143-144
2-007	Ph	5-CF ₃	O	H	Me	245-247
2-008	Cl	5-CF ₃	O	H	Me	193-195
2-009	Br	5-CF ₃	O	H	Me	186-193
2-010	CH ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	205-209
2-011	4-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	173-177
2-012	4-Cl-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	256-258
2-013	SMe	5-CF ₃	O	H	Me	210-215
2-014	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	152-154
2-015	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	170-171
2-016	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	181-184
2-017	D-3 ^a	5-CF ₃	O	H	Me	251-253
2-018	i-Pr	6-CF ₃	O	H	Me	169-171
2-019	n-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	149-150
2-020	CH ₂ OPh	5-CF ₃	O	H	Me	116-117
2-021	c-Pen	5-CF ₃	O	H	Me	197-201
2-022	D-5	5-CF ₃	O	H	Me	147-149
2-023	i-Pr	5-CF ₃	O	Me	Me	215-216
2-024	SEt	5-CF ₃	O	H	Me	157-159
2-025	SCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	200-204
2-026	CH ₂ OEt	5-CF ₃	O	H	Me	183-184
2-027	tBu	5-CF ₃	O	H	Me	217-218
2-028	D-4a	5-CF ₃	O	H	Me	186-188
2-029	CH ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	Me	189-191
2-030	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	155-158
2-031	S(O)Et	5-CF ₃	O	H	Me	190-191
2-032	S(O)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	163-167
2-033	CH ₂ S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	204-206
2-034	CH ₂ S(O) ₂ Ne	5-CF ₃	O	H	Me	212-214
2-035	CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	138-142
2-036	CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	176-178
2-037	S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	*1
2-038	S(O) ₂ Et	5-CF ₃	O	H	Me	*1

2-039	i-Pr	5-CF ₃	S	H	Me	198-200
2-040	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	O	H	Me	202-204
2-041	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ CH ₂ OMe	*1
2-042	4-Me-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	221-225
2-043	4-F-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	236-240
2-044	3-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	210-212
2-045	2-MeO-Ph	5-CF ₃	O	H	Me	150-153
2-046	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ C(O)OMe	149-154
2-047	i-Pr	5-CF ₂ H	O	H	Me	172-173
2-048	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ CH ₂ SMe	*1

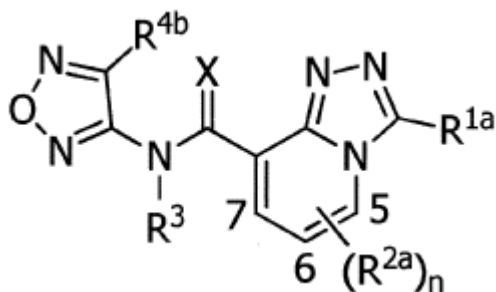
Tabla 32

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-049	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	O	H	Me	240-241
2-050	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	O	H	Me	208-209
2-051	NMe ₂	5-CF ₃	O	H	Me	222-225
2-052	CH(Me)SMe	5-CH ₃	O	H	Me	202-204
2-053	CH(Me)S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	150-152
2-054	CH(Me)S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	117-125
2-055	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	193-198
2-056	NHPh	5-CF ₃	O	H	Me	255-260
2-057	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	Me	144-146
2-058	(CH ₂) ₂ S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	96-102
2-059	(CH ₂) ₂ S(O) ₂ Me	5-CF ₃	O	H	Me	173-175
2-060	D-8a	5-CF ₃	O	H	Me	217-220
2-061	D-11	5-CF ₃	O	H	Me	223-224
2-062	D-10a	5-CF ₃	O	H	Me	246-248
2-063	3,5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	O	H	Me	197-199
2-064	3,5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	O	H	Me	269-271
2-065	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	167-168
2-066	NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	104-107
2-067	S(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	228-229
2-068	S(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	136-138
2-069	S(O)(CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	155-157
2-070	S(O) ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	203-205
2-071	SCH ₂ CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	159-160
2-072	SCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	O	H	Me	170-173
2-073	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Ph	133-136
2-074	NH(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	111-115
2-075	D-14	5-CF ₃	O	H	Me	240-245
2-076	SCH ₂ Ph	5-CF ₃	O	H	Me	179-181
2-077	SCH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	190-192
2-078	D-17	5-CF ₃	O	H	Me	285-290
2-079	N(Me)(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	168-169
2-080	NH(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	O	H	Me	*1
2-081	NHCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	*1
2-082	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	171-172
2-083	N(Me)(c-Hex)	5-CF ₃	O	H	Me	144-145
2-084	SCH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	O	H	Me	168-169
2-085	SCH ₂ (D-15)	5-CF ₃	O	H	Me	139-141
2-086	SCH ₂ CN	5-CF ₃	O	H	Me	144-145
2-087	SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	O	H	Me	160-161
2-088	N(Me)Et	5-CF ₃	O	H	Me	110-112
2-089	N(Et) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	159-160
2-090	i-Pr	5-CF ₃	O	H	n-Pr	111-112
2-091	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ CH=CH ₂	118-119
2-092	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ C(O)OEt	104-105
2-093	i-Pr	5-CF ₃	O	H	CH ₂ (4-Cl-Ph)	147-148
2-094	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	O	H	Me	176-178
2-095	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	O	H	Me	125-128
2-096	S(c-Pen)	5-CF ₃	O	H	Me	192-194

5 Tabla 33

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-097	SCH ₂ (D-8a)	5-CF ₃	O	H	Me	175-178
2-098	SEt	5-CF ₃	O	H	CH ₂ CH ₂ OMe	130-131
2-099	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	O	H	Me	141-142
2-100	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	183-184
2-101	S(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	O	H	Me	144-145
2-102	SCH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	172-174
2-103	SCH ₂ C≡CH	5-CF ₃	O	H	Me	190-191
2-104	i-Pr	5-CF ₃	O	H	H	276-280
2-105	CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	O	H	Me	164-167 (*5)
2-105*	CH=CHMe	5-CF ₃	O	H	Me	164-167 (*5)
2-106	C≡CMe	5-CF ₃	O	H	Me	244-246
2-107	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	O	H	Me	176-178
2-108	CH ₂ OH	5-CF ₃	O	H	Me	155-158
2-109	CHO	5-CF ₃	O	H	Me	250-252
2-110	D-16a	5-CF ₃	O	H	Me	194-201

Sexta tabla



5

Tabla 34

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4b}	Punto de fusión(°C)
3-001	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	185-186
3-002	SCH ₂ CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	O	H	Me	136-137

10

Séptima tabla

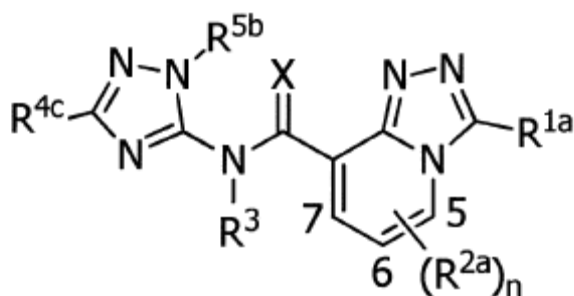


Tabla 35

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4c}	R ^{5b}	Punto de fusión (°C)
4-001	i-Pr	5-CF ₃	O	H	H	Me	182-185
4-002	i-Pr	5-CF ₃	O	H	H	Et	*1
4-003	SEt	5-CF ₃	O	H	H	Me	119-120
4-004	i-Pr	5-CF ₃	O	H	H	H	250-255

15

Octava tabla

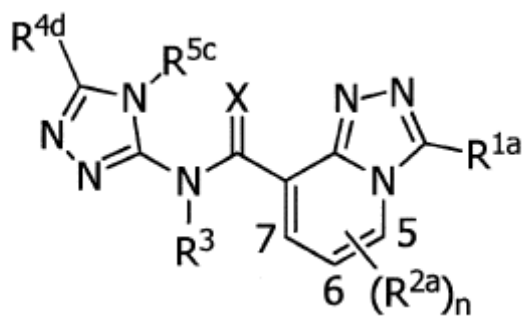
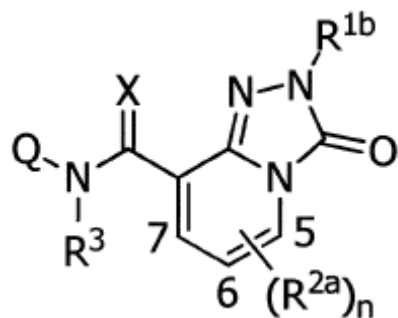


Tabla 36

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	R ^{4d}	R ^{5c}	Punto de fusión (°C)
5-001	i-Pr	5-CF ₃	O	H	Me	Me	215-220
5-002	i-Pr	5-CF ₃	O	H	-CH=CH-CH=CH-		219-223
5-003	i-Pr	5-CF ₃	O	H	-(CH ₂) ₄ -		130-135

5

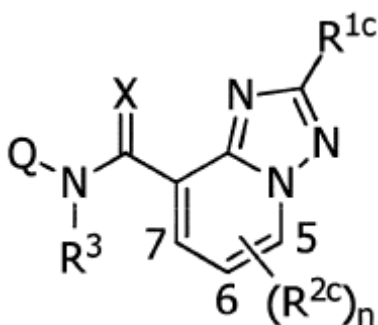
Novena tabla



10 Tabla 37

N.º	Q	R ^{1b}	(R ^{2a}) _n	X	R ³	Punto de fusión (°C)
6-001	D-6a	Me	5-CF ₃	O	H	250-260
6-002	D-7a	Me	5-CF ₃	O	H	245-246
6-003	D-6a	Et	5-CF ₃	O	H	234-236
6-004	D-7a	Et	5-CF ₃	O	H	176-178
6-005	D-6a	i-Pr	5-CF ₃	O	H	184-190
6-006	D-6a	CH ₂ Ph	5-CF ₃	O	H	155-162
6-007	D-20a	Et	5-CF ₃	O	H	182-185
6-008	D-23a	Et	5-CF ₃	O	H	162-164

Décima tabla



15

Tabla 38

N.º	Q	R ^{1c}	(R ^{2c}) _n	X	R ³	Punto de fusión (°C)
-----	---	-----------------	---------------------------------	---	----------------	----------------------

7-001	D-6a	i-Pr	5-CF ₃	O	H	252-255
7-002	D-7a	i-Pr	5-CF ₃	O	H	168-170

Entre los compuestos de la presente invención, los datos de ¹H-RMN de los compuestos que no tienen puntos de fusión y las mezclas de isómeros de “*3”, “*4” y “*5” se enumeran en la decimoprimer tabla.

- 5 Los valores de desplazamiento químico de resonancia magnética nuclear de protón se midieron en un disolvente de cloroformo deuterado a 300 MHz usando Me₄Si (tetrametilsilano) como sustancia de referencia. Los símbolos en la cuarta tabla tienen los siguientes significados. s: singlete, sa: singlete ancho, d: doblete, dd: doblete de dobletes, t: triplete, q: cuartete y m: multiplete.

10 Decimoprimer tabla

Tabla 39

N.º	¹ H-RMN (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
1-003	δ 8,21 (d, 1H, J=7,2Hz), 6,77 (d, 1H, J=7,2Hz), 3,85-3,70 (m, 1H), 2,97 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 1,58 (d, 6H, J=7,2Hz).
1-009	δ 8,24 (d, 1H, J=7,5Hz), 6,67 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,92 (sa, 1H), 4,25-4,10 (m, 1H), 2,75 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 1,60 (d, 6H, J=6,9Hz).
1-037	δ 8,51 (d, 1H, J=6,9Hz), 7,72 (d, 1H, J=6,9Hz), 5,05 (s, 2H), 3,26 (s, 3H), 2,60 (s, 3H). (Pico de protón de CONH no observado).
1-039	δ 8,54 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,76 (d, 1H, J=7,5Hz), 5,17 (s, 2H), 4,36 (q, 2H, J=9,0Hz), 2,60 (Pico de protón de CONH no observado).
1-040	δ 8,54 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,79 (d, 1H, J=7,2Hz), 3,78 (s, 3H), 2,60 (s, 3H). (Pico de protón de CONH no observado).
1-041	δ 8,53 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,78 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,00 (q, 2H, J=7,5Hz), 2,60 (s, 3H), 1,59 (t, H, J=7,5Hz). (Pico de protón de CONH no observado).
1-098	δ 8,34 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,59 (d, 1H, J=7,5Hz), 3,82 (t, 4H, J=4,9Hz), 3,79-3,68 (m, 1H), 3,54 (t, 4H, J=4,9Hz), 1,56 (d, 6H, J=6,5Hz). (Pico de protón de CONH no observado).
1-118	δ 12,68 (sa, 1H), 8,39 (d, 1H, J=7,4Hz), 7,59 (d, 1H, J=7,4Hz), 3,59-3,39 (m, 4H), 3,05-2,78 (m, 4H), 2,59 (s, 3H).
1-158	δ 13,1 (sa, 1H), 8,44 (d, 1H, J=7,5Hz), 8,30 (s, 1H), 7,64 (d, 1H, J=7,5Hz), 6,38-6,25 (m, 1H), 5,38-5,24 (m, 2H), 4,04 (dd, 2H, J=3,9Hz, 1,2Hz).
1-158*	δ 13,0 (sa, 1H), 8,43 (d, 1H, J=6,6Hz), 8,30 (s, 1H), 7,62 (d, 1H, J=6,6Hz), 7,11-7,01 (m, 1H), 6,71-6,61 (m, 1H), 2,10 (d, 3H, J=6,6Hz).
1-159	δ 12,9 (sa, 1H), 8,42 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,63 (d, 1H, J=7,5Hz), 6,38-6,24 (m, 1H), 5,36-5,23 (m, 2H), 4,03 (dd, 2H, J=6,9Hz, 1,2Hz), 2,59 (s, 3H).
1-159*	δ 12,9 (sa, 1H), 8,38 (d, 1H, J=6,9Hz), 7,60 (d, 1H, J=6,9Hz), 7,12-7,00 (m, 1H), 6,69-6,62 (m, 1H), 2,60 (s, 3H), 2,09 (dd, 3H, J=6,6Hz, 1,8Hz).
1-160	δ 12,8 (sa, 1H), 8,46 (d, 1H, J=7,2Hz), 8,31 (s, 1H), 7,65 (d, 1H, J=7,2Hz), 2,27 (s,3H).
1-161	δ 12,6 (sa, 1H), 8,44 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,64 (d, 1H, J=7,2Hz), 2,59 (s,3H), 2,27 (s,3H).
1-174	δ 7,72 (d, 1H, J=7,8Hz), 7,53 (d, 1H, J=7,8Hz), 4,15 (q, 2H, J=7,2Hz), 2,78 (d, 1H, J=7,8Hz), 2,38 (s, 3H), 1,83 (d, 1H, J=7,8Hz), 1,80 (s, 3H), 1,43 (t, 3H, J=7,2Hz).
2-037	δ 12,08 (sa, 1H), 8,62 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,86 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,12 (s, 3H), 3,80 (s, 3H).
2-038	δ 12,11 (sa, 1H), 8,62 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,86 (d, 1H, J=7,2Hz), 4,12 (s,3 H), 4,01 (q, 2H, J=7,2Hz), 1,60 (t, 3H, J=7,2Hz).
2-041	δ 12,49 (sa, 1H), 8,35 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,62 (d, 1H, 7,5MHz), 4,65-4,55 (m, 2H), 3,90-3,80 (m, 2H), 3,75-3,65 (m, 1H), 3,38 (s, 3H), 1,60-1,50 (m, 6H).

15 Tabla 40

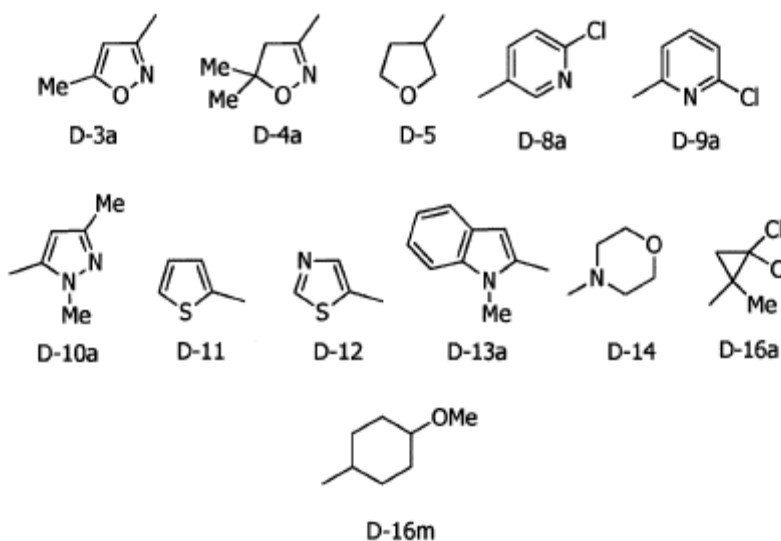
N.º	¹ H-RMN (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
2-048	δ 12,6 (sa, 1H), 8,35 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,64 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,60 (t, 2H, J=7,2Hz), 3,80-3,65 (m, 1H), 3,09 (t, 2H, J=7,2Hz), 2,11 (s, 3H), 1,56 (d, 6H, J=6,9Hz).
2-080	δ 12,4 (sa, 1H), 8,14 (d, 1H, J=6,6Hz), 7,40 (d, 1H, J=6,6Hz), 5,24 (sa, 1H), 4,11 (s, 3H), 3,88-3,80 (m, 2H), 2,99-2,91 (m, 2H), 2,16 (s, 3H).
2-081	δ 12,3 (sa, 1H), 8,23 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,49 (d, 1H, J=7,2Hz), 4,78 (sa, 1H), 4,45-4,32 (m, 2H), 4,11 (s,3 H).
2-105	δ 12,5 (sa, 1H), 8,40 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,65 (d, 1H, J=7,5Hz), 6,37-6,24 (m, 1H), 5,37-5,24 (m, 2H), 4,13 (s, 3H), 4,06 (dd, 2H, J=6,6Hz, 1,2Hz).
2-105*	δ 12,5 (sa, 1H), 8,36 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,62 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,13-7,01 (m, 1H), 6,70-6,62 (m, 1H), 4,13 (s, 3H), 2,10 (dd, 3H, J=6,6Hz, 1,5Hz).
4-002	δ 12,3 (sa, 1H), 8,37 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,88 (s, 1H), 7,61 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,23 (q, 2H, J=7,5Hz),

3,80-3,60 (m, 1H), 1,60-1,50 (m, 9H).

Ejemplo de referencia

Ejemplo de referencia 1

- 5 Los compuestos enumerados en la decimosegunda tabla se sintetizaron mediante un método similar a la etapa 1 del ejemplo de síntesis 7. En las tablas, Me es grupo metilo. De manera similar, Et es grupo etilo, Pr es grupo propilo, Pen es grupo pentilo, Ph es grupo fenilo, Bn es grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo y t- es terciario.
- 10 En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a y D-16m son las siguientes estructuras.



- 15 En las tablas, “*1” es “resinoso”. Los datos de ¹H-RMN de los compuestos que no tienen puntos de fusión se enumeran en la decimosexta tabla. Los valores de desplazamiento químico de resonancia magnética nuclear de protón en la decimosexta tabla se midieron en un disolvente de cloroformo deuterado a 300 MHz usando Me₄Si (tetrametilsilano) como sustancia de referencia. Los símbolos en la decimosexta tabla tienen los siguientes significados. s: singlete, sa: singlete ancho, d: doblete, dd: doblete de dobletes, t: triplete, q: cuartete y m: multiplete.
- 20 Decimosegunda tabla

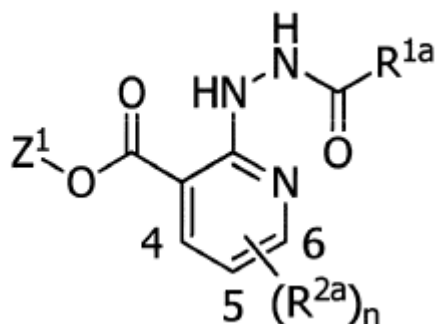


Tabla 41

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	Punto de fusión (°C)
A1-01a	H	6-CF ₃	Me	*1
A1-02a	c-Pr	6-CF ₃	Me	143-144
A1-03a	3-Pen	6-CF ₃	Me	125-126
A1-04a	Ph	6-CF ₃	Me	*1
A1-05a	CH ₂ OMe	6-CF ₃	Me	76-77
A1-06a	4-MeO-Ph	6-CF ₃	Me	116-120

A1-07a	4-Cl-Ph	6-CF ₃	Me	163-165
A1-08a	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	6-CF ₃	Me	*1
A1-09a	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	6-CF ₃	Me	82-85
A1-10a	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	6-CF ₃	Me	148-149
A1-11a	D-3a	6-CF ₃	Me	121-122
A1-12a	i-Pr	5-CF ₃	Me	130-131
A1-13a	n-Pr	6-CF ₃	Me	119-120
A1-14a	CH ₂ OPh	6-CF ₃	Me	95-97
A1-15a	c-Pen	6-CF ₃	Me	158-159
A1-16a	D-5	6-CF ₃	Me	155-156
A1-17a	CH ₂ OEt	6-CF ₃	Me	55-57
A1-18a	t-Bu	6-CF ₃	Me	144-146
A1-19a	D-4a	6-CF ₃	Me	99-100
A1-20a	CH ₂ SMe	6-CF ₃	Me	127-129
A1-21a	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	6-CF ₃	Me	114-116
A1-22b	CH ₂ C(O)OEt	6-CF ₃	Bn	110-112
A1-23a	4-Me-Ph	6-CF ₃	Me	183-185
A1-24a	4-F-Ph	6-CF ₃	Me	117-119
A1-25a	4-CF ₃ -Ph	6-CF ₃	Me	160-162
A1-26a	3-MeO-Ph	6-CF ₃	Me	103-106
A1-27a	2-MeO-Ph	6-CF ₃	Me	160-164
A1-28a	i-Pr	6-CF ₂ H	Me	140-141
A1-29a	D-8a	6-CF ₃	Me	172-175
A1-30a	D-9a	6-CF ₃	Me	160-170
A1-31a	D-10a	6-CF ₃	Me	161-163.
A1-32a	D-11	6-CF ₃	Me	45-50
A1-33a	D-12	6-CF ₃	Me	40-45
A1-34a	D-13a	6-CF ₃	Me	183-184
A1-35b	CH ₂ OC(O)Me	6-CF ₃	Bn	89-91
A1-36a	CH ₂ (4-MeO-Ph)	6-CF ₃	Me	121-122
A1-37c	i-Pr	6-CF ₂ CF ₃	Et	120-121
A1-38a	3,5-(MeO) ₂ -Ph	6-CF ₃	Me	106-107
A1-39a	3,5-(Cl) ₂ -Ph	6-CF ₃	Me	178-179
A1-40a	i-Pr	5-Me-6-CF ₃	Me	169-174
A1-41c	i-Pr	4-Me-6-CF ₃	Et	140-141
A1-42a	(CH ₂) ₂ SMe	6-CF ₃	Me	90-91
A1-43a	CH(Me)SMe	6-CF ₃	Me	166-167
A1-44c	i-Pr	6-Ph	Et	144-146
A1-45c	i-Pr	6-{3,5-(F) ₂ -Ph}	Et	144-146
A1-46a	NMe ₂	6-CF ₃	Me	134-137
A1-47c	D-14	6-CF ₃	Et	101-105
A1-48a	CH ₂ (c-Pr)	6-CF ₃	Me	119-122

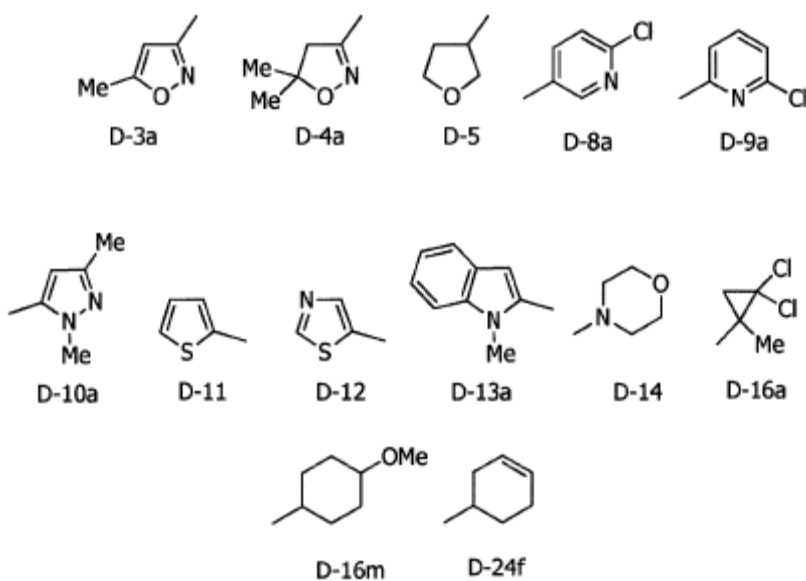
Tabla 42

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	Punto de fusión (°C)
A1-49a	D-16a	6-CF ₃	Me	70-75
A1-50a	C≡CMe	6-CF ₃	Me	151-153
A1-51a	CH ₂ CF ₃	6-CF ₃	Me	170-172
A1-52a	CH ₂ CN	6-CF ₃	Me	163-165
A1-53c	D-16m	6-CF ₃	Et	120-125
A1-55c	(CH ₂) ₂ OMe	6-CF ₃	Et	96-98

5 Ejemplo de referencia 2

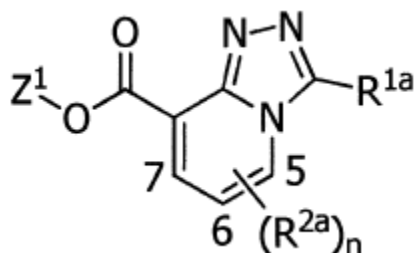
Se sintetizaron los compuestos enumerados en la decimotercera tabla mediante un método similar a la etapa 2 del ejemplo de síntesis 7. En las tablas, Me es grupo metilo. De manera similar, Et es grupo etilo, Pr es grupo propilo, Pen es grupo pentilo, Ph es grupo fenilo, Bn es grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo y t- es terciario.

10 En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, D-16m y D-24f son las siguientes estructuras.



5 En las tablas, “*1” es “resinoso”. Los datos de $^1\text{H-RMN}$ de los compuestos que no tienen puntos de fusión se enumeran en la decimosexta tabla.

Decimotercera tabla



10

Tabla 43

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	Punto de fusión (°C)
B1-01a	H	5-CF ₃	Me	*1
B1-02a	c-Pr	5-CF ₃	Me	*1
B1-04a	Ph	5-CF ₃	Me	*1
B1-05a	CH ₂ OMe	5-CF ₃	Me	95-97
B1-06a	4-MeO-Ph	5-CF ₃	Me	160-162
B1-07a	4-Cl-Ph	5-CF ₃	Me	148-152
B1-08a	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	Me	*1
B1-09a	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	Me	87-89
B1-10a	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	Me	86-94
B1-11a	D-3a	5-CF ₃	Me	140-141
B1-12a	i-Pr	6-CF ₃	Me	105-107
B1-13a	n-Pr	5-CF ₃	Me	129-130
B1-14a	CH ₂ OPh	5-CF ₃	Me	102-103
B1-15a	c-Pen	5-CF ₃	Me	130-134
B1-17a	CH ₂ OEt	5-CF ₃	Me	87-89
B1-18a	t-Bu	5-CF ₃	Me	75-77
B1-19a	D-4a	5-CF ₃	Me	137-139
B1-20a	CH ₂ SMe	5-CF ₃	Me	97-99
B1-21a	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	Me	125-126
B1-22b	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	Bn	72-73
B1-23a	4-Me-Ph	5-CF ₃	Me	142-145
B1-24a	4-F-Ph	5-CF ₃	Me	133-135
B1-25a	4-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	Me	170-171
B1-26a	3-MeO-Ph	5-CF ₃	Me	135-142

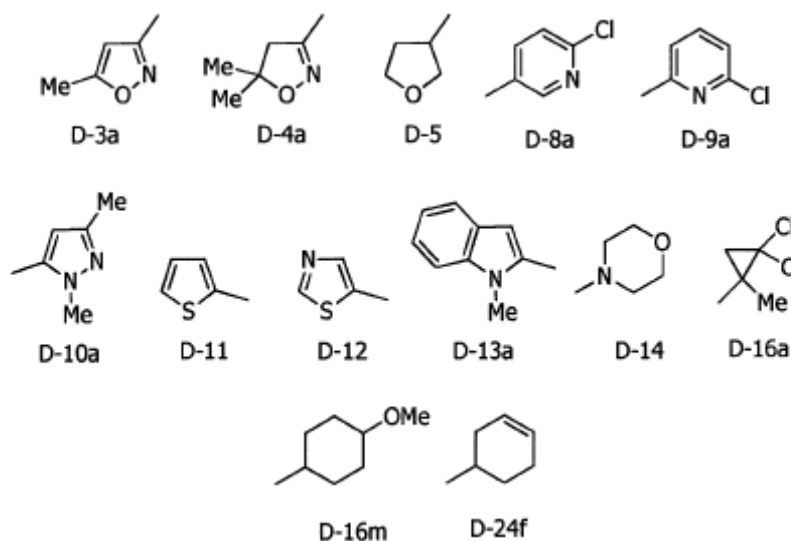
B1-27a	2-MeO-Ph	5-CF ₃	Me	*1
B1-28a	i-Pr	5-CF ₂ H	Me	142-145
B1-29a	D-8a	5-CF ₃	Me	*1
B1-30a	D-9a	5-CF ₃	Me	140-145
B1-31a	D-10a	5-CF ₃	Me	126-129
B1-32a	D-11	5-CF ₃	Me	122-124
B1-33a	D-12	5-CF ₃	Me	171-172
B1-34a	D-13a	5-CF ₃	Me	*1
B1-35b	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	Bn	88-89
B1-36a	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	Me	92-110
B1-37c	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	Et	57-58
B1-38a	3,5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	Me	150-161
B1-39a	3,5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	Me	157-164
B1-40a	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	Me	58-59
B1-41c	i-Pr	5-CF ₃ -7-Me	Et	76-77
B1-42a	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	Me	126-127
B1-43a	CH(Me)SMe	5-CF ₃	Me	103-104
B1-44c	i-Pr	5-Ph	Et	133-134
B1-45c	i-Pr	5-[3,5-(F) ₂ -Ph]	Et	125-127
B1-46a	NMe ₂	5-CF ₃	Me	135-137
B1-47c	D-14	5-CF ₃	Et	138-139
B1-48a	CH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	Me	130-135
B1-49a	D-16a	5-CF ₃	Me	*1
B1-50a	C≡CMe	5-CF ₃	Me	163-168

[Tabla 44

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	Punto de fusión (°C)
B1-51a	CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	Me	150-154
B1-52a	CH ₂ CN	5-CF ₃	Me	165-170
B1-53c	D-16m	5-CF ₃	Et	95-102
B1-54c	D-24f	5-CF ₃	Et	101-110
B1-55c	(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	Et	82-83

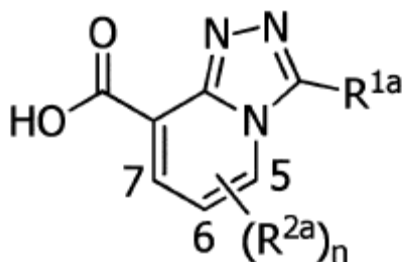
Ejemplo de referencia 3

- 5 Se sintetizaron los compuestos enumerados en la decimocuarta tabla mediante un método similar a la etapa 3 del ejemplo de síntesis 7. En las tablas, Me es grupo metilo. De manera similar, Et es grupo etilo, Pr es grupo propilo, Pen es grupo pentilo, Ph es grupo fenilo, Bn es grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo y t- es terciario.
- 10 En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, D-16m y D-24f son las siguientes estructuras.



- 15 En las tablas, “*1” es “resinoso”. Los datos de ¹H-RMN de los compuestos que no tienen puntos de fusión se enumeran en decimosexta tabla.

Decimocuarta tabla



5 Tabla 45

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Punto de fusión (°C)
C1-01	H	5-CF ₃	*1
C1-02	c-Pr	5-CF ₃	*1
C1-03	3-Pen	5-CF ₃	137-139
C1-04	Ph	5-CF ₃	*1
C1-05	CH ₂ OMe	5-CF ₃	111-112
C1-06	4-MeO-Ph	5-CF ₃	215-218
C1-07	4-Cl-Ph	5-CF ₃	241-247
C1-08	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	47-49
C1-09	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	67-70
C1-10	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-CF ₃	137-140
C1-11	D-3a	5-CF ₃	197-201
C1-12	i-Pr	6-CF ₃	224-226
C1-13	n-Pr	5-CF ₃	134-135
C1-14	CH ₂ OPh	5-CF ₃	136-140
C1-15	c-Pen	5-CF ₃	156-158
C1-16	D-5	5-CF ₃	195-200
C1-17	CH ₂ OEt	5-CF ₃	96-97
C1-18	t-Bu	5-CF ₃	125-131
C1-19	D-4a	5-CF ₃	184-186
C1-20	CH ₂ SMe	5-CF ₃	110-111
C1-21	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	56-59
C1-22	CH ₂ C(O)OEt	5-CF ₃	124-126
C1-23	4-Me-Ph	5-CF ₃	250-253
C1-24	4-F-Ph	5-CF ₃	249-251
C1-25	4-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	199-201
C1-26	3-MeO-Ph	5-CF ₃	179-181
C1-27	2-MeO-Ph	5-CF ₃	85-90
C1-28	i-Pr	5-CF ₂ H	193-195
C1-29	D-8a	5-CF ₃	237-240
C1-30	D-9a	5-CF ₃	231-234
C1-31	D-10a	5-CF ₃	215-220
C1-32	D-11	5-CF ₃	190-195
C1-33	D-12	5-CF ₃	218-223
C1-34	D-13a	5-CF ₃	185-188
C1-35	CH ₂ OC(O)Me	5-CF ₃	126-128
C1-36	CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	73-75
C1-37	i-Pr	5-CF ₂ CF ₃	170-175
C1-38	3,5-(MeO) ₂ -Ph	5-CF ₃	158-160
C1-39	3,5-(Cl) ₂ -Ph	5-CF ₃	250-252
C1-40	i-Pr	5-CF ₃ -6-Me	153-154
C1-41	i-Pr	5-CF ₃ -7-Me	190-192
C1-42	(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	149-151
C1-43	CH(Me)SMe	5-CF ₃	145-146
C1-44	i-Pr	5-Ph	218-219
C1-45	i-Pr	5-{3,5-(F) ₂ -Ph}	210-220
C1-46	NMe ₂	5-CF ₃	181-183
C1-47	D-14	5-CF ₃	210-213
C1-48	CH ₂ (c-Pr)	5-CF ₃	109-114

Tabla 46

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Punto de fusión (°C)
C1-49	D-16a	5-CF ₃	159-164
C1-50	C≡CMe	5-CF ₃	234-238
C1-51	CH ₂ CF ₃	5-CF ₃	168-171
C1-52	CH ₂ CN	5-CF ₃	227-231
C1-53	D-16m	5-CF ₃	118-120
C1-54	D-24f	5-CF ₃	169-170
C1-55	(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	104-105

Ejemplo de referencia 4

- 5 Ácido 3-(etilio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico
- Etapa 1; Síntesis de ácido 3-(tioxo)-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico
- 10 A 20 ml de disolución en metanol de 2,0 g de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo sintetizado mediante un método similar a la etapa 1 del ejemplo de síntesis 8 que contiene imidazol, se le añadieron 17 ml de disolución acuosa de hidróxido de sodio 0,5 mol/l bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción a temperatura ambiente durante 3,5 horas. Tras la finalización de la reacción, se añadieron 20 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l a la disolución de reacción y se separó el sólido precipitado en la disolución de reacción mediante filtración. Se lavó el sólido obtenido con ácido clorhídrico 1 mol/l, agua y diisopropil éter en este orden y se filtró para dar 1,1 g del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 235°C a 240°C.

- 20 Etapa 2; Síntesis de ácido 3-(etilio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

- 25 A 10 ml de disolución en N,N-dimetilformamida de 700 mg (2,66 mmol) de ácido 3-(tioxo)-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, se añadieron 898 mg (5,76 mmol) de yoduro de etilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción a temperatura ambiente durante 4 días. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Al residuo obtenido, se le añadieron 5 ml de agua y 5 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l y se separó el sólido precipitado mediante filtración. Se lavó el sólido obtenido con agua y diisopropil éter en este orden para dar 486 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

- 30 Punto de fusión: de 113°C a 114°C.

Ejemplo de referencia 5

- 35 Se sintetizaron los siguientes compuestos mediante métodos similares a la etapa 2 y la etapa 3 del ejemplo de síntesis 8 o el ejemplo de referencia 4.

3-(Isopropiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

- 40 Punto de fusión: de 120°C a 122°C.

Ácido 3-(isopropiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 135°C a 136°C.

- 45 Ácido 3-((2-metoxietil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 106°C a 111°C.

Ácido 3-(aliltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

- 50 Punto de fusión: de 96°C a 99°C.

Ácido 3-(prop-2-in-1-iltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

- 55 Punto de fusión: de 179°C a 181°C.

3-(n-Propiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 87°C a 88°C.

Ácido 3-(n-propiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

5 Punto de fusión: de 106°C a 108°C.

3-(Isobutiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 105°C a 106°C.

10 Ácido 3-(isobutiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 110°C a 112°C.

15 3-(s-Butiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 88°C a 90°C.

Ácido 3-(s-butiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

20 Punto de fusión: de 107°C a 109°C

3-(Benciltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

25 Punto de fusión: de 130°C a 135°C.

Ácido 3-(benciltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 153°C a 156°C.

30 3-((4-Metoxibencil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 119°C a 121°C.

35 Ácido 3-((4-metoxibencil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 180°C a 182°C.

3-((Ciclopropilmetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

40 Punto de fusión: de 122°C a 123°C.

Ácido 3-((ciclopropilmetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

45 Punto de fusión: de 127°C a 129°C.

3-(((Tetrahidrofurano-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

50 ¹H-RMN (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7,95 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,42 (d, 1H, J=7,2Hz), 4,34-4,25 (m, 1H), 4,09 (s, 3H), 3,92-3,84 (m, 1H), 3,79-3,68 (m, 2H), 3,56-3,49 (m, 1H), 2,17-2,06 (m, 1H), 1,99-1,87 (m, 2H), 1,76-1,68 (m, 1H).

Ácido 3-(((tetrahidrofurano-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 108°C a 112°C.

55 3-((Cianometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 146°C a 148°C.

60 Ácido 3-((cianometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 138°C a 140°C.

3-((2-Oxopropil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

65 Punto de fusión: de 84°C a 87°C.

Ácido 3-((2-oxopropil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 121°C a 124°C.

5

3-(((1,3-Dioxolan-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 99°C a 102°C.

10

Ácido 3-(((1,3-dioxolan-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 110°C a 112°C.

15

Ácido 3-((2,2,2-trifluoroetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 150°C a 151°C.

Ácido 3-((2-metoxi-2-oxoetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

20

Punto de fusión: de 143°C a 144°C.

3-(Ciclopentiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 92°C a 94°C.

25

Ácido 3-(ciclopentiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

Punto de fusión: de 143°C a 146°C.

30

3-(((6-Cloropiridin-3-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 99°C a 100°C.

35

3-(((6-Cloropiridin-3-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato.

Punto de fusión: de 159°C a 160°C.

Ejemplo de referencia 6

40

Síntesis de 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

A la mezcla de 500 mg (1,91 mmol) de 3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo, 525 mg (3,82 mmol) de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se le añadieron 298 mg (2,10 mmol) de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción a temperatura ambiente durante 5 horas. Tras la finalización de la reacción, se añadieron 20 ml de cloroformo a la disolución de reacción y se separó el sólido precipitado mediante filtración. Se eliminó por destilación el disolvente en la disolución obtenida mediante la filtración a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido tras eliminar por destilación el disolvente con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo (gradiente desde 17:3 hasta 2:3) para dar 312 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

50

Punto de fusión: de 189°C a 190°C

Se sintetizaron los siguientes compuestos mediante un método similar.

55

2-Etil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 135°C a 137°C.

60

2-Isopropil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 124°C a 125°C.

65

2-Bencil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo.

Punto de fusión: de 99°C a 100°C.

Ejemplo de referencia 7

Síntesis de ácido 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

5 A 3 ml de disolución en etanol de 312 mg (1,13 mmol) de 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo, se le añadieron 3 ml de disolución acuosa de 50 mg (1,25 mmol) de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 1 hora a la misma temperatura. Tras la finalización de la reacción, se añadieron 3 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l a la disolución de reacción y se extrajo la mezcla resultante con diclorometano (10 ml, 3 veces). Se deshidrató la fase orgánica obtenida y se secó con disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y sulfato de sodio anhidro en este orden y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter y se filtró para dar 250 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

15 Punto de fusión: de 155°C a 160°C.

Se sintetizaron los siguientes compuestos mediante un método similar.

Ácido 2-etil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

20 Punto de fusión: de 160°C a 163°C.

Ácido 2-isopropil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

25 Punto de fusión: de 160°C a 162°C.

Ácido 2-bencil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico.

30 Punto de fusión: de 84°C a 86°C.

Ejemplo de referencia 8

Síntesis de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

35 Se disolvieron 100 mg de la mezcla de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo sintetizado mediante el método de la etapa 1 del ejemplo de síntesis 8 e imidazol en 50 ml de acetato de etilo y se lavó la mezcla resultante con 20 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l. Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida para dar 63 mg del producto objetivo como un sólido naranja-amarillo.

40 Punto de fusión: de 218°C a 220°C.

Ejemplo de referencia 9

45 Ácido 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

Etapas 1; Síntesis de 2-(2-(fenilcarbamoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo

50 A 13 ml de disolución en tetrahidrofurano de 500 mg (2,13 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo, se le añadieron 255 mg (2,14 mmol) de isocianato de fenilo bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 14 horas a la misma temperatura. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter para dar 740 mg del producto objetivo como un sólido blanco.

55 Punto de fusión: de 190°C a 195°C.

Etapas 2; Síntesis de 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo

60 A la disolución mezclada de 730 mg (2,06 mmol) de 2-(2-(fenilcarbamoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo y 15 ml de tolueno, se le añadieron 940 mg (6,11 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 3 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la agitación, se enfrió la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente y se añadió a hielo-agua para terminar la reacción. Después de eso, se extrajo el líquido de reacción con acetato de etilo (30 ml, 2 veces). Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo-metanol (gradiente desde 90:10:0 hasta 0:100:0 hasta 0:90:10) para dar

480 mg del producto objetivo como un sólido amarillo.

Punto de fusión: de 225°C a 230°C.

5 Etapa 3; Síntesis de ácido 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

10 A la disolución mezclada de 470 mg (1,40 mmol) de 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de metilo y 10 ml de metanol, se le añadieron 8,0 ml (8,0 mmol) de disolución acuosa de hidróxido de sodio 1 mol/l bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 3 horas bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida y después de eso se añadió ácido clorhídrico 1 N a la disolución de reacción para ajustar el pH a de 5 a 6. Se extrajo el líquido mezclada de reacción con acetato de etilo (30 ml, 2 veces) y se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro, seguido por eliminación por destilación del disolvente a presión reducida. Se lavó el sólido precipitado con diisopropil éter para dar 250 mg del producto objetivo como un sólido naranja.

15 Punto de fusión: de 125°C a 130°C.

20 Ejemplo de referencia 10

Ácido 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

Etapa 1; Síntesis de 2-(2-((2-metoxietil)(metil)carbamoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de etilo

25 Se agitó una mezcla de 500 mg (1,82 mmol) de 3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de etilo, 320 mg (3,59 mmol) de N-(2-metoxietil)metilamina y 10 ml de tetrahidrofurano durante 3 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo (gradiente desde 90:10 hasta 0:100) para dar 610 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo claro.

30 Punto de fusión: de 65°C a 66°C.

35 Etapa 2; Síntesis de 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de etilo

40 A la disolución mezclada de 595 mg (1,63 mmol) de 2-(2-((2-metoxietil)(metil)carbamoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de etilo y 10 ml de tolueno, se le añadieron 750 mg (4,94 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Tras la finalización de la adición, se agitó la mezcla de reacción durante 1,5 horas bajo calentamiento hasta reflujo. Tras la finalización de la agitación, se enfrió la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente y se añadió a hielo-agua para terminar la reacción. Posteriormente se añadió disolución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio para ajustar el pH a de 8 a 9. Después de eso, se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo (30 ml, 2 veces). Se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro y se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida. Se purificó el residuo obtenido con la cromatografía de líquidos preparativa de presión media eluyendo el residuo con n-hexano-acetato de etilo (gradiente desde 90:10 hasta 0:100) para dar 520 mg del producto objetivo como un líquido naranja.

¹H-RMN (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7,91 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,80 (d, 1H, J=7,2Hz), 4,55 (q, 2H, J=6,9Hz), 3,75-3,41 (m, 4H), 3,27 (s, 3H), 2,87 (s, 3H), 1,48 (t, 3H, J=6,9Hz).

50 Etapa 3; Síntesis de ácido 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico

55 A la disolución mezclada de 500 mg (1,44 mmol) de 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxilato de etilo y 10 ml de etanol, se le añadieron 4,5 ml (4,5 mmol) de disolución acuosa de hidróxido de sodio 1 mol/l bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la adición, se agitó la disolución de reacción durante 1 hora bajo enfriamiento con hielo. Tras la finalización de la reacción, se eliminó por destilación el disolvente en la disolución de reacción a presión reducida y después de eso se añadió ácido clorhídrico 1 mol/l a la disolución de reacción para ajustar el pH a 4. Se extrajo el líquido mezclada de reacción con acetato de etilo (30 ml, 2 veces) y se secó la fase orgánica obtenida sobre sulfato de sodio anhidro, seguido por eliminación por destilación del disolvente a presión reducida para dar 470 mg del producto objetivo como un sólido de color amarillo claro.

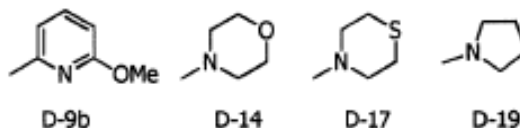
60 Punto de fusión: de 115°C a 120°C.

Ejemplo de referencia 11

65 Se sintetizaron los compuestos enumerados en la decimoquinta tabla mediante un método similar al ejemplo de referencia 9 o el ejemplo de referencia 10. En las tablas, Me es grupo metilo. De manera similar, Et es grupo etilo,

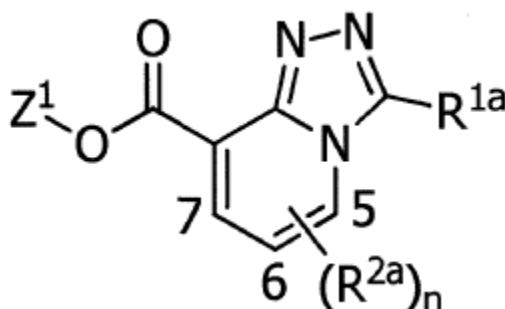
Ph es grupo fenilo y c- es ciclo.

En las tablas, los sustituyentes de D-9b, D-14, D-17 y D-19 son las siguientes estructuras.



5

Decimoquinta tabla



10 Tabla 47

N.º	R ^{1a}	(R ^{2a}) _n	Z ¹	Punto de fusión (°C)
C2-01	N(Me)Ph	5-CF ₃	H	160-170
C2-02	NHCH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H	145-146
C2-03	D-14	5-CF ₃	H	210-213
C2-04	NH(D-9b)	5-CF ₃	H	170-174
C2-05	NH(CH ₂) ₂ OMe	5-CF ₃	H	150-155
C2-06	NHSO ₂ Ph	5-CF ₃	H	>290
C2-07	D-17	5-CF ₃	H	160-165
C2-08	NH(CH ₂) ₂ SMe	5-CF ₃	H	173-176
C2-09	NHCH ₂ CF ₃	5-CF ₃	H	180-183
C2-10	N(Me)CH(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H	135-137
C2-11	N(Me)Hex-c	5-CF ₃	H	184-186
C2-12	N(Me)Et	5-CF ₃	H	140-141
C2-13	N(Et) ₂	5-CF ₃	H	126-127
C2-14	D-19	5-CF ₃	H	150-151
C2-15	N(Me)CH ₂ C≡CH	5-CF ₃	H	133-134
C2-16	N(Me)(CH ₂) ₂ CN	5-CF ₃	H	136-137
C2-17	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF ₃	H	168-171
C2-18	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	5-CF ₃	H	117-118
C2-19	N(Me)CH ₂ (4-MeO-Ph)	5-CF ₃	H	105-110

Decimosexta tabla

15 Tabla 48

N.º	¹ H-RMN (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
A1-01a	δ 10,02 (sa, 1H), 8,34 (d, 1H, J=7,8Hz), 8,26 (s, 1H), 8,23 (sa, 1H), 7,11 (d, 1H, J=7,8Hz), 3,96 (s, 3H).
A1-04a	δ 10,21 (d, 1H, J=6,0Hz), 8,84 (d, 1H, J=5,7Hz), 8,35 (dd, 1H, J=7,2Hz, 0,9Hz), 7,88-7,85 (m, 2H), 7,56-7,46 (m, 3H), 7,08 (d, 1H, J=7,8Hz), 3,98 (s, 3H).
A1-08a	δ 9,70 (sa, 1H), 9,26 (sa, 1H), 8,32 (d, 1H, J=7,8Hz), 7,07 (d, 1H, J=7,8Hz), 4,21 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,89-3,86 (m, 2H), 3,65-3,62 (m, 2H), 3,40 (s, 3H).
B1-01a	δ 9,04 (d, 1H, J=1,8Hz), 8,14 (d, 1H, J=6,6Hz), 7,41 (d, 1H, J=6,6Hz), 4,13 (s, 3H).
B1-02a	δ 7,95 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,44 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,09 (s, 3H), 2,32-2,25 (m, 1H), 1,38-1,33 (m, 2H), 1,22-1,16 (m, 2H).
B1-04a	δ 8,04 (dd, 1H, J=7,2Hz, 0,6Hz), 7,60-7,42 (m, 6H), 4,14 (s, 3H).
B1-08a	δ 8,04 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,49 (d, 1H, J=7,2Hz), 5,21 (d, 2H, J=0,9Hz), 4,11 (s, 3H), 3,75-3,12

B1-27a	(m, 2H), 3,54-3,51 (m, 2H), 3,33 (s, 3H). δ 8,04 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,45-7,60 (m, 1H), 7,35-7,45 (m, 2H), 7,00-7,15 (m, 1H), 6,90-7,00 (m, 1H), 4,13 (s, 3H), 3,65 (s, 3H).
B1-29a	δ 8,49 (s, 1H), 8,00-8,15 (m, 1H), 7,75-7,85 (m, 1H), 7,40-7,60 (m, 2H), 4,13(s, 3H).
B1-34a	δ 8,17 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,70 (d, 1H, J=8,1Hz), 7,54 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,35-7,45 (m, 2H), 7,20-7,30 (m, 2H), 4,17 (s, 3H), 3,54 (s, 3H).
B1-49a	δ 8,00 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,54 (d, 1H, J=7,5Hz), 4,10 (s, 3H), 2,91 (d, 1H, J=7,5Hz), 1,91 (d, 1H, J=7,5Hz), 1,85 (s, 3H).
C1-01	δ 9,06 (d, 1H, J=1,5Hz), 8,33 (d, 1H, J=7,2Hz), 7,57 (d, 1H, J=6,9Hz). (Pico de protón de CO ₂ H no observado).
C1-02	δ 8,38 (d, 1H, J=7,5Hz), 7,60 (d, 1H, H=7,5Hz), 2,39-2,28 (m, 1H), 1,42-1,35 (m, 2H), 1,29-1,23 (m, 2H). (Pico de protón de CO ₂ H no observado).
C1-04	δ 8,30 (d, 1H, J=6,9Hz), 7,60-7,49 (m, 6H). (Pico de protón de CO ₂ H no observado).

Ejemplos de prueba

5 Posteriormente, la utilidad del compuesto de la presente invención como herbicida se describirá específicamente en los siguientes ejemplos de prueba. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos de prueba.

Ejemplo de prueba 1. Prueba de actividad herbicida mediante aplicación antes de la generación de malas hierbas en condiciones sumergidas

10 Tras colocar suelo aluvial en 1/10000 áreas de maceta de Wagner, se vertió agua y se mezcló para formar una condición sumergida que tenía una profundidad de agua de 4 cm. Se sembraron semillas de *Echinochloa oryzacola* Vasing., *Scirpus juncooides* y *Monochoria vaginalis* de una manera mixta en la maceta anterior y después de eso se trasplantaron plántulas de *Oryza sativa* en fase de 2,5 hojas. El día de la siembra de las semillas, se diluyó con agua el agente de emulsión que contenía el compuesto de la presente invención preparado según el ejemplo de formulación 2 para que fuese una cantidad de herbicida predeterminada y se aplicó el compuesto diluido a la superficie del agua. Se colocó la maceta en un invernadero de 25°C a 30°C para cultivar la planta. Tres semanas después de la aplicación del herbicida, se investigaron los efectos sobre cada planta según los siguientes criterios. Los resultados se enumeran en la decimoséptima tabla.

20 Criterios

5 Razón de herbicida del 90% o más (casi completamente marchita)

25 4 Razón de herbicida del 70% o más y menos del 90%

3 Razón de herbicida del 40% o más y menos del 70%

2 Razón de herbicida del 20% o más y menos del 40%

30 1 Razón de herbicida del 5% o más y menos del 20%

0 Razón de herbicida del 5% o menos (casi sin efecto)

35 Ejemplo de prueba 2. Prueba de actividad herbicida mediante aplicación durante la generación de malas hierbas en condiciones sumergidas

40 Tras colocar suelo aluvial en 1/10000 áreas de maceta de Wagner, se vertió agua y se mezcló para formar una condición sumergida que tenía una profundidad de agua de 4 cm. Se sembraron semillas de *Echinochloa oryzacola* Vasing., *Scirpus juncooides* y *Monochoria vaginalis* de una manera mixta en la maceta anterior y se colocó la maceta en el invernadero de 25°C a 30°C para cultivar las plantas. Cuando se cultivaron *Echinochloa oryzacola* Vasing., *Scirpus juncooides* y *Monochoria vaginalis* hasta de una fase de una hoja a una fase de dos hojas, se diluyó con agua el agente de emulsión que contenía el compuesto de la presente invención preparado según el ejemplo de formulación 2 para que fuese una cantidad de herbicida predeterminada y se aplicó el compuesto diluido a la superficie del agua. Tres semanas después de la aplicación del herbicida, se investigaron los efectos sobre cada planta según los criterios del ejemplo de prueba 1. Los resultados se enumeran en la decimooctava tabla.

Ejemplo de prueba 3. Prueba de efecto herbicida mediante aplicación al follaje

50 Tras colocarse suelo aluvial en 1/10000 áreas de maceta de Wagner, se vertió agua y se mezcló para formar una condición que tenía una profundidad de agua de 0,1 cm a 0,5 cm. Se sembraron semillas de *Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*, *Leptochloa chinensis*, *Cyperus difformis* y *Oryza sativa* y se colocó la maceta en el invernadero de 25°C a 30°C para cultivar las plantas. Después de que las plantas se cultivaron durante 14 días, se diluyó con agua

el agente de emulsión que contenía el compuesto de la presente invención preparado según el ejemplo de formulación 2 para que fuese una cantidad de herbicida predeterminada y se aplicó uniformemente el compuesto diluido a una parte de tallo y hoja con un pulverizador de tamaño pequeño. Tres semanas después de la aplicación del herbicida, se investigaron los efectos sobre cada planta según los criterios del ejemplo de prueba 1. Los resultados se enumeran en la decimonovena tabla.

Ejemplo de prueba 4. Prueba de efecto herbicida mediante aplicación al follaje

Se colocó suelo aluvial esterilizado en una caja de plástico que tenía una longitud de 21 cm, una anchura de 13 cm y una profundidad de 7 cm. Se sembraron cada una de las semillas de *Digitaria ciliaris*, *Setaria viridis*, *Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Lolium multiflorum* Lam., *Apera spica-venti.*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album*, *Stellaria media*, *Galium spurium*, *Veronica persica*, *Zea mays*, *Glycine max*, *Oryza sativa*, *Triticum aestivum*, *Beta vulgaris* ssp. *vulgaris* y *Brassica campestris* L. de una manera de tipo puntual y se cubrió con el suelo de aproximadamente 1,5 cm de grosor. Después de eso, se cultivaron las plantas en el invernadero de 25°C a 30°C. Después de que las plantas se cultivaron durante 14 días, se diluyó con agua el agente de emulsión que contenía el compuesto de la presente invención preparado según el ejemplo de formulación 2 para que fuese una cantidad de herbicida predeterminada y se aplicó uniformemente el compuesto diluido a una parte de tallo y hoja con un pulverizador de tamaño pequeño. Tres semanas después de la aplicación del herbicida, se investigaron los efectos sobre cada planta según los criterios del ejemplo de prueba 1. Los resultados se enumeran en la vigésima tabla.

Los símbolos en la decimoséptima tabla a la vigésima tabla tienen los siguientes significados.

A: *Echinochloa oryzicola* Vasing., B: *Scirpus juncooides*, C: *Monochoria vaginalis*, D: *Leptochloa chinensis*, E: *Cyperus difformis*, F: *Digitaria ciliaris*, G: *Setaria viridis*, H: *Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*, I: *Avena fatua*, J: *Alopecurus myosuroides*, K: *Lolium multiflorum* Lam., L: *Apera spica-venti.*, M: *Abutilon theophrasti*, N: *Amaranthus retroflexus*, O: *Chenopodium album*, P: *Stellaria media*, Q: *Galium spurium*, R: *Veronica persica*, a: *Oryza sativa* trasplantada, b: *Oryza sativa* sembrada directamente, c: *Zea mays*, d: *Glycine max*, e: *Triticum aestivum*, f: *Beta vulgaris* ssp. *vulgaris* y g: *Brassica campestris* L.

La cantidad de aplicación de herbicida (g/ha) significa la cantidad a la que se ajusta una concentración de modo que, cuando la cantidad de aplicación se convierte en por hectárea (1 ha), el herbicida se aplica mediante el número de gramos (g) del valor descrito.

Decimoséptima tabla

Tabla 49

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-001	320	3	2	2	0
1-002	320	2	1	0	0
1-004	320	5	4	4	1
1-005	320	5	4	4	0
1-010	320	5	3		0
1-011	320	5	4	5	1
1-012	320	5	3	4	0
1-014	320	5	4	3	0
1-015	320	2	3	3	0
1-016	320	4	0	0	0
1-017	320	3	2	0	0
1-018	320	1	3	5	0
1-019	320	5	3	4	2
1-020	320	4	3	2	0
1-021	320	5	4	4	2
1-022	320	2	2	0	0
1-024	320	5	2	0	0
1-026	320	5	4	4	2
1-027	320	5	3	4	1
1-029	320	5	3	4	2
1-030	320	5	3	3	0
1-031	320	4	3	3	0
1-032	320	5	3	2	2
1-033	320	5	4	3	0
1-034	320	4	4	4	3
1-035	320	5	4	4	2

ES 2 651 491 T3

1-036	320	4	3	3	4
1-037	320	0	2	3	0
1-038	320	2	2	1	0
1-040	320	3	3	3	1
1-041	320	3	3	3	0
1-042	320	2	2	2	0
1-043	320	5	3	3	3
1-044	320	5	3	3	1
1-046	320	5	3	3	2
1-047	320	4	3	2	1
1-048	320	3	0	0	1
1-049	320	5	2	0	0
1-050	320	5	5	4	2
1-051	320	5	4	4	0
1-052	320	3	3	2	0
1-053	320	2	3	2	0
1-054	320	5	3	4	2
1-055	320	4	4	4	1
1-056	320	5	5	4	3
1-057	320	5	5	4	2
1-058	320	5	5	4	4

Tabla 50

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-059	320	2	3	2	0
1-060	320	4	4	3	2
1-062	320	3	2	1	0
1-063	320	5	4	3	0
1-064	320	5	4	3	0
1-065	320	5	3	2	0
1-066	320	5	4	2	2
1-067	320	3	0	0	0
1-068	320	2	3	3	0
1-069	320	5	4	3	0
1-070	320	5	5	5	3
1-071	320	4	5	4	0
1-073	320	4	3	2	3
1-074	320	2	2	0	0
1-075	320	2	0	2	0
1-076	320	5	4	4	3
1-077	320	0	0	2	0
1-078	320	4	4	3	4
1-079	320	4	4	3	4
1-080	320	5	4	4	4
1-082	320	3	2	2	0
1-083	320	2	3	3	0
1-084	320	2	3	2	0
1-085	320	3	4	3	3
1-086	320	5	4	4	5
1-087	320	5		3	0
1-090	320	3	4	2	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	4	3
1-093	320	5	4	3	0
1-094	320	5	5	3	0
1-095	320	5	5	5	1
1-096	320	5	4	4	3
1-100	320	4	3	3	0
1-102	320	3	2	2	2
1-103	320	5	4	4	3
1-104	320	4	3	2	0
1-105	320	5	5	4	0
1-106	320	5	5	4	1
1-107	320	5	4	5	2

ES 2 651 491 T3

1-108	320	5	5	5	0
1-109	320	0	2	0	0
1-110	320	5	4	4	4
1-112	320	3	3	2	0
1-113	320	4	3	2	0
1-114	320	3	2	0	0
1-115	320	5	4	3	0

Tabla 51

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-116	320	5	4	2	0
1-118	320	3	2	0	2
1-119	320	2	1	0	3
1-120	320	5	3	1	3
1-121	320	5	4	4	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	5	4	4	1
1-124	320	3	3	1	0
1-125	320	0	3	1	0
1-126	320	3	4	2	0
1-128	288	5	4	2	0
1-129	320	5	4	3	1
1-130	320	1	0	0	1
1-131	320	2	1	0	0
1-132	320	5	4	4	2
1-133	320	5	3	4	0
1-134	320	3	3	2	0
1-135	320	3	4	4	1
1-136	320	5	3	3	1
1-137	320	5	5	5	3
1-138	320	5	5	4	2
1-139	320	5	4	3	2
1-143	320	0	0	2	0
1-144	320	5	3	3	1
1-145	320	5	5	5	4
1-146	320	5	5	5	3
1-147	320	5	5	5	2
1-148	320	5	5	5	4
1-149	320	5	4	3	3
1-150	320	5	5	5	4
1-151	320	5	5	3	0
1-152	320	5	4	3	2
1-153	320	3	3	4	2
1-154	320		3	2	0
1-155	320		4	3	0
1-156	320		2	0	0
1-157	320		3	2	2
1-158	320		4	0	0
1-159	320		3	0	0
1-161	320		2	0	0
1-162	320		2	0	0
1-163	320		4	4	2
1-164	320		5	4	3
1-165	320	4	3	4	0
1-166	320		3	2	0
1-167	320	4	2	0	0
1-169	320	5	4	4	0

5 Tabla 52

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-171	320	5	4	4	1

1-172	320	5	4	3	1
2-001	320	2	3	4	0
2-002	320	2	3	3	0
2-003	320	5	5	5	4
2-005	320	5	5	5	0
2-006	320	5	5	5	4
2-007	320	5	5	5	3
2-008	320	4	4	4	1
2-009	320	3	3	4	0
2-010	320	5	5	4	4
2-011	320	5	5	5	2
2-012	320	5	4	3	1
2-013	320	5	4	5	3
2-014	320	5	5	5	4
2-015	320	5	5	5	1
2-016	320	5	5	5	4
2-017	320	5	3	4	4
2-019	320	5	5	4	2
2-020	320	3	2	2	1
2-021	320	5	5	5	4
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	2	1	0	3
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	4	4
2-027	320	5	5	5	4
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	5	4	4	3
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	4	5	4
2-034	320	5	4	4	4
2-035	320	4	3	3	4
2-037	320	5	5	5	4
2-038	320	5	5	5	4
2-039	320	5	5	5	4
2-040	320	4	4	4	4
2-041	320	5	5	4	0
2-042	320	5	4	4	5
2-043	320	5	5	5	4
2-044	320	5	5	5	4
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	4	0	0	0
2-047	320	5	4	5	4
2-048	320	5	5	4	4

Tabla 53

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C	a
2-049	320	5	5	4	3
2-050	192	4	2	3	2
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	4	5
2-054	320	5	5	5	5
2-056	320	4	4	3	1
2-057	320	4	4	4	4
2-058	320	4	4	5	5
2-059	320	4	4	4	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	4
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5		5	4
2-064	320	5		2	3

ES 2 651 491 T3

2-065	320	5	4	4	2
2-066	320	5	5	4	3
2-067	320	5	4	4	5
2-068	320	5	5	4	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	4
2-071	320	5	5	5	4
2-072	320	5	5	5	3
2-073	320	4	3	4	2
2-074	320	4	4	3	3
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	3	2
2-077	320	5	3	3	1
2-078	320	5	4	2	4
2-079	320	5	5	5	4
2-080	320	3	0	0	2
2-081	320	4	3	4	3
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	5	5	4	2
2-084	320	5	5	4	4
2-085	320	5	5	4	1
2-086	320	3	2	3	0
2-087	320	5	5	4	3
2-088	141	5	5	5	3
2-089	320	5	5	5	4
2-090	320	5	5	5	4
2-091	320	5	5	5	0
2-093	320	5	5	4	2
2-094	320	5	5	5	4
2-095	320	5	5	5	5
2-096	320		5	4	3
2-097	320		4	3	1

Tabla 54

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C	a
2-098	320		5	4	2
2-099	320	5	4	5	4
2-100	320	5	5	5	3
2-101	320	5	5	5	3
2-102	320	5	5	4	1
2-103	320	5	4	5	3
2-105	320	5	5	5	4
2-106	320	5	3	4	2
2-107	320	2	3	2	1
2-108	320	4	3	2	0
2-109	260	2	3		0
2-110	320	5	5	5	4
4-003	320		2	0	0
6-002	320	4	3	2	0
6-004	320	0	0	2	0
7-001	320	0	2	4	0
7-002	320	3	3	4	1

5 Decimoctava tabla

Tabla 55

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C
1-001	320	4	4	2
1-002	320	3	0	0
1-004	320	4	3	4
1-005	320	5	1	0

ES 2 651 491 T3

1-010	320	4	1	4
1-011	320	5	3	3
1-012	320	2	2	2
1-014	280	2	3	0
1-015	320	4	2	1
1-016	320	3	0	0
1-017	320	2	2	0
1-018	320	0	2	0
1-019	320	4	3	3
1-020	320	2	2	2
1-021	320	4	4	3
1-022	320	2	2	0
1-024	320	4	1	0
1-026	320	3	1	0
1-027	320	4	3	3
1-029	320	3	2	3
1-030	320	4	3	3
1-031	320	3	2	2
1-032	320	4	3	3
1-033	320	4	4	3
1-034	320	4	3	4
1-035	320	5	4	4
1-036	320	3	2	4
1-037	320	2	2	
1-038	320	1	1	0
1-040	320	3	2	
1-041	320	2	3	
1-042	320	1	2	3
1-043	320	3	3	3
1-044	320	2	3	2
1-046	320	4		
1-047	320	3	2	3
1-048	320	0	1	0
1-049	320	4	2	2
1-050	320	5	4	3
1-051	320	4	3	4
1-052	320	1	1	0
1-053	320	1	2	0
1-054	320	4	3	3
1-055	320	3	3	3
1-056	320	5	4	4
1-057	320	2	3	3
1-058	320	4	5	4

Tabla 56

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C
1-059	320	2	3	2
1-060	320	2	3	2
1-061	320	0	1	1
1-062	320	2	2	2
1-063	320	4	3	2
1-064	320	2	3	2
1-065	320	1	2	2
1-066	320	2	3	2
1-068	320	2	2	2
1-069	320	4	4	4
1-070	320	5	5	5
1-071	320	3	5	4
1-073	320	2	2	1
1-074	320	2	0	0
1-076	320	2	0	4
1-078	320	4	3	3
1-079	320	4	3	4
1-080	320	5	3	4

ES 2 651 491 T3

1-083	320	2	2	2
1-084	320	2	1	0
1-085	320	3	2	2
1-086	320	4	4	4
1-087	320	4		3
1-090	320	2	1	3
1-091	320	5	5	5
1-092	320	4	4	3
1-093	320	3	3	3
1-094	320	4	3	3
1-095	320	4	5	4
1-096	320	4	3	4
1-100	320	4	3	4
1-102	320	1	1	1
1-103	320	4	5	4
1-104	320	4	3	3
1-105	320	3	4	3
1-106	320	5	5	4
1-107	320	5	4	4
1-108	320	4	4	3
1-109	320	0	1	0
1-110	320	4	3	4
1-112	320	1	2	0
1-113	320	2	0	0
1-114	320	0	1	0
1-115	320	3	3	
1-116	320	3	4	0
1-118	320	2	3	0
1-119	320	4	1	0

Tabla 57

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C
1-120	320	3	3	2
1-121	320	4	4	4
1-122	320	4	3	3
1-123	320	3	2	3
1-124	320	3	3	1
1-125	320	0	2	1
1-126	320	1	3	3
1-128	288	1	3	0
1-129	320	3	4	3
1-131	320	0	1	0
1-132	320	4	4	4
1-133	320	2	2	3
1-134	320	1	3	3
1-135	320	2	2	3
1-136	320	0	2	2
1-137	320	3	3	3
1-138	320	3	3	3
1-139	320	4	3	3
1-144	320	4	4	3
1-145	320	4	4	4
1-146	320	3	3	3
1-147	320	4	2	3
1-148	320	5	5	4
1-149	320	3	3	2
1-150	320	5	5	4
1-151	320	4	4	2
1-152	320	3	3	3
1-153	320	3	3	3
1-154	320	0	2	0
1-155	320	1	2	0
1-156	320	0	3	2
1-157	320	0	1	0

ES 2 651 491 T3

1-158	320	2	3	0
1-159	320	3		
1-162	320	3	1	0
1-163	320	4		
1-164	320	4	4	4
1-165	320	2	2	
1-166	320	2	3	
1-168	320	2	2	
1-169	320	3	4	4
1-171	320	4		
1-172	320	3	4	3
1-173	320	3	2	2
2-001	320	2	2	3
2-002	320	2	1	2
2-003	320	5	3	4

Tabla 58

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C
2-005	320	5	3	4
2-006	320	5	5	5
2-007	320	4	4	4
2-008	320	3	2	3
2-009	320	3	2	3
2-010	320	5	4	4
2-011	320	4	3	4
2-012	320	4	5	5
2-013	320	5	3	2
2-014	320	5	5	5
2-015	320	4	5	4
2-016	320	5	5	5
2-017	320	5	4	4
2-019	320	4	3	4
2-020	320	2	2	0
2-021	320	5	4	4
2-022	320	5	5	4
2-023	320	0	1	1
2-024	320	5	4	4
2-025	320	5	4	5
2-026	320	5	5	4
2-027	320	5	4	4
2-028	320	5	4	4
2-029	320	5	4	4
2-030	320	4	3	4
2-031	320	5	4	4
2-032	320	5	5	5
2-033	320	4	3	4
2-034	320	5	4	4
2-035	320	2	2	3
2-037	320	5	5	5
2-038	320	5	4	5
2-039	320	5	5	5
2-040	320	4	3	4
2-041	320	5	4	3
2-042	320	4	3	4
2-043	320	5	4	4
2-044	320	5	4	4
2-045	320	5	3	4
2-047	320	3	5	4
2-048	320	3	4	3
2-049	320	5	5	4
2-050	192	1	0	2
2-051	320	5	5	5
2-052	320	5	4	4
2-053	320	5	4	4

2-054	320	5	4	5
-------	-----	---	---	---

Tabla 59

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C
2-056	320	3	3	3
2-057	320	4	4	4
2-058	320	4	4	4
2-059	320	4	3	4
2-060	320	5	3	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-060	320	5	4	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-063	320	5	4	5
2-064	320	3	4	3
2-065	320	5	4	4
2-066	320	3		3
2-067	320	5	4	5
2-068	320	5	5	4
2-069	320	5	5	5
2-070	320	5	5	5
2-071	320	3	5	5
2-072	320	5	5	5
2-073	320	2	2	3
2-074	320	4	4	3
2-075	320	5	5	5
2-076	320	2	3	2
2-077	320	2	2	2
2-078	320	4	4	3
2-079	320	5	5	5
2-080	320	2	1	0
2-081	320	2	2	2
2-082	320	5	4	3
2-083	320	3	3	3
2-084	320	4	4	3
2-085	320	4	4	3
2-086	320	0	2	1
2-087	320	4	4	3
2-088	141	4	3	4
2-089	320	4	4	5
2-090	320	5	5	4
2-091	320	4	5	4
2-093	320	2	4	3
2-094	320	5	5	4
2-095	320	4	5	5
2-096	320	3	3	3
2-097	320	0	2	2
2-098	320	5	4	3
2-099	320	5	5	4
2-100	320	4	3	4

5 Tabla 60

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	A	B	C
2-101	320	4	4	5
2-102	320	4	4	4
2-103	320	4	3	4
2-105	320	4	4	4
2-106	320	1	2	3
2-107	320	2	1	2
2-108	320	0	1	

ES 2 651 491 T3

2-109	260	1	1	
2-110	320	5	5	4
6-002	320	3	2	3
6-004	320	3	0	2
7-002	320	4	2	2

Decimonovena tabla

Tabla 61

5

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-001	320	5	5	4	0
1-002	400	4	4		0
1-004	400	4	5	5	0
1-005	400	2	5	5	0
1-008	320	3	0		0
1-010	400	5	5	4	0
1-011	400	5	5	5	0
1-012	400	3	5		0
1-013	320	3	4	3	0
1-014	320	5	2	4	1
1-015	320	5	5	4	1
1-016	320	5	5	5	1
1-017	320	4	3	4	0
1-018	320	4	4	4	2
1-019	320	5	5	5	4
1-020	320	5	4	4	2
1-021	320	5	5	5	3
1-022	320	5	5	4	2
1-024	320	5	4	4	2
1-025	320	4	3	2	2
1-026	320	5	4	4	4
1-027	320	5	5	5	3
1-029	320	4	5	4	4
1-030	320	5	5	5	4
1-031	320	5	4	3	2
1-032	320	5	5	5	2
1-033	320	5	5	5	1
1-034	320	5	5	5	5
1-035	320	5	5	5	4
1-036	320	5	5	5	4
1-037	320	5	5	5	2
1-038	320	5	5	4	2
1-039	320	3	3	3	2
1-040	320	4	5	4	3
1-041	320	4	5	5	2
1-042	320	5		4	1
1-043	320	5	4	5	5
1-044	320	5	4	4	3
1-045	320	1	3	4	0
1-046	320	5	3	3	3
1-047	320	5	5	4	3
1-048	320	5	4	3	0
1-049	320	5	4	4	1
1-050	320	5	5	5	1
1-051	320	4	5	4	0
1-052	320	4	5	5	0
1-053	320	4	4	4	0

Tabla 62

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-054	320	5	5	5	3

1-055	320	5	4	5	2
1-056	320	5	5	5	4
1-057	320	5	5	5	3
1-058	320	5	5	5	4
1-059	320	0	3	3	0
1-060	320	5	4	3	2
1-061	320	5	4	3	1
1-062	320	5	4	4	2
1-063	320	5	5	5	2
1-064	320	5	4	4	2
1-065	320	3	1	3	0
1-066	320	1	4	3	0
1-067	320	5	5	5	2
1-068	320	5	5	5	1
1-069	320	5	5	5	1
1-070	320	4	5	5	0
1-071	320	0	3	5	0
1-072	320	2	1	0	0
1-073	320	5	5	5	4
1-074	320	5	4	3	0
1-075	320	5	4	4	1
1-076	320	5	5	5	3
1-077	320	5	4	3	0
1-078	320	5	5	5	5
1-079	320	5	5	5	5
1-080	320	5	5	5	5
1-081	320	2	0	0	0
1-082	320	4	4	4	0
1-083	320	5	5	5	2
1-084	320	5	5	5	2
1-085	320	5	5	5	3
1-086	320	5	5	5	0
1-087	320	5	5	5	1
1-089	224	3	3	2	0
1-090	320	5	5	5	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	5	4
1-093	320	4	5	4	1
1-094	320	5	4	4	1
1-095	320	4	4	4	1
1-096	320	5	5	4	4
1-100	320	5	5	4	0
1-101	320	1	0	0	0
1-102	320	4	5	4	2
1-103	320	5	5	5	4
1-104	320	5	5	4	0

Tabla 63

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-105	320	5	5	5	0
1-106	320	5	5	5	3
1-107	320	5	5	5	3
1-108	320	5	5	5	1
1-109	320	5	5	3	2
1-110	320	5	5	5	5
1-112	320	3	2	1	0
1-113	320	4	3	3	0
1-114	320	4	4	2	0
1-115	320	5	4	4	0
1-116	320	4	4	0	0
1-117	320	4	4	2	0
1-118	320	5	5	3	3
1-119	320	5	5	2	3
1-120	320	5	5	5	3

1-121	320	5	5	5	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	4	4	4	1
1-124	320	4	4	4	0
1-125	320	5	4	3	1
1-126	320	4	4	4	0
1-127	320	4	4	3	0
1-128	288	4	3	3	0
1-129	320	5	5	4	3
1-130	320	5	4	2	2
1-131	320	4	4	3	2
1-132	320	5	5	4	3
1-133	320	4	2	0	0
1-134	320	5	4	2	2
1-135	320	5	4	2	1
1-136	320	4	4	0	2
1-137	320	5	5	4	3
1-138	320	5	5	4	3
1-139	320	4	5	5	1
1-141	320	4	2	3	1
1-142	320	3	1	0	0
1-143	320	4	2	4	0
1-144	320	5	4	2	
1-145	320	5	5	5	
1-146	320	5	5	4	
1-147	320	5	5	3	
1-148	320	5	5	5	
1-149	320	5	5	5	
1-150	320	5	5	5	
1-151	320	5	4	4	
1-152	320	5	5	4	
1-153	320	5	5	3	

Tabla 64

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-154	320	3	2	4	
1-155	320	1	2	5	
1-156	320	3	2	2	
1-157	320	4	3	4	
1-158	320	5	4	4	
1-159	320	5	3	0	
1-162	320	4	4	2	
1-163	320	5	5	4	
1-164	320	5	5	4	
1-165	320	5	4		0
1-166	320	4	3		2
1-167	320	1	2		
1-168	320	4	3		3
1-169	320	5	4		1
1-170	320	2	4		1
1-171	320	4	4		0
1-172	320	5	5		3
1-173	320	5	4		2
1-174	320	2	2		0
2-001	320	4	4	3	1
2-002	320	5	4	2	2
2-003	200	5	5	5	0
2-005	320	5	5	4	2
2-006	320	5	5	5	5
2-007	320	5	5	5	4
2-008	320	4	5	4	0
2-009	320	5	4	3	4
2-010	320	5	5	5	5
2-011	320	5	5	5	5

ES 2 651 491 T3

2-012	320	4	5	5	2
2-013	320	5	5	5	5
2-014	320	5	5	5	5
2-015	320	5	5	5	4
2-016	320	5	5	5	5
2-017	320	5	5	5	5
2-019	320	5	5	5	5
2-020	320	4	4	4	4
2-021	320	5	5	5	5
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	4	1	0	1
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	5	5
2-027	320	5	5	5	5
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	4	5	4	5

Tabla 65

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	H	D	E	b
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5
2-034	320	5	5	5	5
2-035	320	5	5	4	5
2-036	320	4	5	4	1
2-037	320	5	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5
2-039	320	5		5	4
2-040	320	4		5	4
2-041	320	5	5	5	3
2-042	320	5	5	5	5
2-043	320	5	5	5	5
2-044	320	5	5	5	5
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	2	3	3	0
2-047	320	4	5	5	3
2-048	320	5	5	5	3
2-049	320	5	5	5	1
2-050	192	4	3	3	0
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5
2-055	131	2	0	0	0
2-056	320	4	5	4	4
2-057	320	5	5	5	5
2-058	320	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	5
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5	5	5	3
2-064	320	1	4	5	0
2-065	320	5	5	5	3
2-066	320	5	5	5	3
2-067	320	5	5	5	5
2-068	320	5	5	5	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	3
2-071	320	4	5	5	3
2-072	320	4	5	5	1
2-073	320	4	3	5	2

2-074	320	5	5	4	5
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	4	1
2-077	320	2	4	3	0

Tabla 66

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	H	D	E	b
2-078	320	5	5	3	4
2-079	320	5	5	5	5
2-080	320	4	5	5	3
2-081	320	5	5	5	4
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	4	4	5	0
2-084	320	5	5	5	5
2-085	320	5	5	4	4
2-086	320	5	5	4	3
2-087	320	5	5	5	3
2-088	141	5	5	4	3
2-089	320	4	5	4	2
2-090	320	5	4	5	
2-091	320	5	3	4	
2-092	320	2	3	2	
2-093	320	1	2	5	
2-094	320	5	5	5	
2-095	320	5	5	5	
2-096	320	0	0	5	
2-097	320	2	3	4	
2-098	320	5	5	5	
2-099	320	5	5		4
2-100	320	5	5		3
2-101	320	5	5		4
2-102	320	5	4		1
2-103	320	5	5		1
2-105	320	5	4		5
2-106	320	1	2		0
2-107	320	4	5		4
2-108	320	4	5		4
2-109	260	3	5		2
2-110	320	5	5		3
3-002	320	0	3		0
4-002	320	0	4	0	0
4-003	320	4	3	0	
5-001	320	1	0	0	0
6-002	320	5	5	4	0
6-003	320	1	5	0	0
6-004	320	4	5	2	3
7-001	320	1	2		
7-002	320	4	4	4	0

5 Vigésima tabla

Tabla 67

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-001	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	4	4	0	0	3	1	4	4
1-002	320	4	2	5	3	1	2	1	3	3	5	5	4		0	0	3	1	5	4
1-004	320	5	4	5	2	2	2	3	4	4	5	5	1	4	0	4	4	1	4	3
1-005	320	3	3	4	1	0	0	0	4	3	5	1	0	3	0	1	0	0	0	0
1-008	320	3	1	5	0	0	0	0	0	2	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-010	320	3	3	4	3	2	1	2	5	5	5	5	1	5	0	1	4	1	5	3
1-011	320	5	4	5	1	1	1	2	5	5	5	5	2	5	0	3	4	0	5	3

ES 2 651 491 T3

1-012	320	3	4	4	0	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	1	2	0	3	4
1-013	320	3	1	4	0	1	1	0	3	3	5	4	1	3	0	0	0	1	3	0
1-014	320	3	3	4	1	1	1	0	4	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	2
1-015	320	4	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	4	2	5	4
1-016	320	4	2	5	1	1	1	0	5	5	5	5	2	4	0	0	0	0	5	3
1-017	320	3	0	5	0	0	0	0	5	5	5	4	0	4	0	0	3	0	5	3
1-018	320	0	2	1	0	0	0	0	3	4	5	4	0	4	0	0	0	0	1	0
1-019	320	5	4	5	3	2	2	4	4	5	5	5	4	4	2	2	4	3	5	4
1-020	320	4	3	5	1	1	1	1	2	4	5	4	3	3	0	1	0	1	5	3
1-021	320	4	3	4	1	1	1	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	3
1-022	320	4	3	5	1	1	1	1	5	5	5	4	2	4	0	2	3	1	4	2
1-024	320	4	3	4	1	0	0	1	4	5	5	4	3	4	0	2	4	0	4	4
1-025	320	3	2	4	0	0	0	0	5	3	5	4	3	3	0	0	3	0	5	2
1-026	320	3	3	3	1	1	1	2	3	4	5	5	2	5	0	0	3	1	5	3
1-027	320	5	4	5	2	2	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	5	2	5	4
1-029	320	5	4	5	1	1	1	1	5	5	5	5	0	5	3	1	3	1	5	1
1-030	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	3	2	5	3	5	4
1-031	320	4	4	5	2	1	1	1	5	4	5	4	3	4	0	1	3	1	3	3
1-032	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	2	4	0	0	4	1	5	4
1-033	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	2	3	1	5	4
1-034	320	5	5	5	3	1	3	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	2	5	4
1-035	320	5	5	5	2	2	2	3	5	5	5	5	2	5	4	3	4	2	5	3
1-036	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	3	3	4	3	5	5
1-037	320	5	4	4	3	2	2	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	5	4
1-038	320	5	5	5	3	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	0	4	1	5	4
1-039	320	2	0	4	0	0	0	0	0	1	4	0	0	0	0	0	0	0	2	0
1-040	320	5	4	4	3	3	3	4	5	5	5	5	3	5	0	0	1	3	5	1
1-041	320	5	4	5	3	1	2	4	5	5	5	5	3	4	0	0	2	3	5	0
1-042	320	4	3	5	2	0	0	2	4	4	5	4	3	4	0	1	3	0	5	3
1-043	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4	4	2	2	0	5	3
1-044	320	4	4	5	1	1	2	4	5	5	5	4	3	5	0	0	3	0	5	4
1-045	320	3	1	2	0	0	0	0	4	4	5	2	2	3	0	0	1	0	3	3
1-046	320	5	5	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	1	2	3	0	5	4
1-047	320	4	4	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	0	1	3	0	5	4
1-048	320	5	3	5	2	1	1	2	5	4	5	4	3	4	0	0	4	1	5	4
1-049	320	5	4	5	0	2	2	3	5	5	5	4	3	4	0	4	3	1	5	4
1-050	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2	5	1	3	4	3	5	5
1-051	320	3	3	4	1	0	1	1	5	3	5	3	2	3	0	0	1	1	3	1
1-052	320	3	1	2	0	1	1	3	4	4	5	2	1	3	0	0	2	0	3	3
1-053	320	3	2	3	1	0	0	0	4	4	5	2	2	4	0	0	3	0	3	1

Tabla 68

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-054	320	5	4	5	3	3	3	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	4	4
1-055	320	4	3	4	1	3	2	3	5	5	5	5	2	4	0	0	3	1	5	4
1-056	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	4	4	4	1	5	5
1-057	320	4	4	4	3	2	2	5	5	5	5	1	5	0	1	3	0	5	3	
1-058	320	5	5	5	3	3	3	2	5	5	5	5	2	5	5	4	4	1	5	4
1-059	320	0	0	2	0	0	0	0	4	2	5	2	0	2	0	0	0	0	0	0
1-060	320	5	3	5	3	2	2	1	4	4	5	4	3	5	3	0	4	3	5	4
1-061	320	3	3	4	3	1	1	1	5	5	5	4	4	5	1	1	4	0	4	4
1-062	320	5	3	5	3	1	0	1	5	4	5	4	4	4	3	0	3	2	4	4
1-063	320	5	5	5	2	2	2	3	4	4	5	4	3	5	0	3	4	2	5	3
1-064	320	5	4	5	1	1	1	1	3	4		3	3	0	0	3	0	4	3	
1-065	320	4	1	1	1	0	0	0	3	3	5	4	0	3	0	0	3	0	4	2
1-066	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	4	1	4	0	0	3	0	4	0
1-067	320	5	4	5	1	0	0	0	4	1	5	4	3	4	2	0	3	0	4	4
1-068	320	5	4	5	1	1	1	1	3	3	5	4	3	4	2	0	3	1	4	4
1-069	320	5	5	5	2	2	2	4	3	3	5		3		0	1	3	1	5	3
1-070	320	4	4	5	1	0	0	0	4	4	5	5	3		0	0	4	0	4	3
1-071	320	1	0	0	0	0	0	0	3	2	5		1	3	0	0	0	0	2	0
1-072	320	0	0	3	0	0	0	0	1	0	4	2	0	1	0	0	0	0	0	0
1-073	320	5	5	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2		5	0	4	3	5	3

ES 2 651 491 T3

1-074	320	4	4	5	1	0	0	0		4	5	4	3	3	0	0	3	0	4	3
1-075	320	3	1	3	0	0	0	0	1	2	5	3	0	3	0	0	0	0	1	1
1-076	320	5	5	5	3	3	3	4	4	4	5	5	2	4	0	3	3	3	5	4
1-077	320	4	2	4	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	3	0	3	3
1-078	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	4	4		4	4	4	5	4	
1-079	320	5	5	5	4	2	3		5	5	5	5	4		4	1	5	4	5	5
1-080	320	5	5	5	4	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5
1-081	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	2		0	0	0	0	1	0	0
1-082	320	4	3	4	0	0	1	1	4	3	5		0	4	0	0	3	0		0
1-083	320	5	5	5	3	0	1	0	5	5	5	4	4	4	1	1	4	1	5	4
1-084	320	5	5	5	3	0	0	0	5	5	5	4	4	5	3	1	4	0	4	4
1-085	320	5	5	5		3	3	3	5	5	5	4	4	5	3	3	4	3	4	4
1-086	320	5	4	5	0	0	0	0	5	4	5	5	1	4	1	1	1	0	5	4
1-087	320	5	5	5	3	3	1	2	5	5	5	4	1	4	0	4	4	2	5	4
1-088	320	0	0	0	0	0	0	0	0	1	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-089	224	1	0	3	2	0	0	0	2	1	4	4	0	3	0	0	1	0	3	1
1-090	320	5	3	5	3	1	1	1	3		5	4	1	5	0	1	4	0	5	4
1-091	320	5	5	5	4	2	3	3	5	5	5	5	4	5	0	2	4	3	5	5
1-092	320	5	5	5	2	1	1	1	4	4	5	5	3	5	5	1	4	0	5	3
1-093	320	5	3	5	1	0	1	1	4	4	5	4	1	4	0	4	3	0	5	3
1-094	320	5	4	5	2	1	1	1	4	4	5	5	0	4	0	4	3	1	5	3
1-095	320	5	3	5	1	1	2	1	4	4	5	5	3	5	0	2	3	1	5	3
1-096	320	5	5	5	2	1	2	3	4	5	5	4	4	5	4	4	4	1	5	5
1-100	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	3	0	1	0	0	1	0	3	0
1-102	320	3	3	4	0	0	0	0	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	4	2
1-103	320	5	5	5	4	2	3	3	4	5	5	5	4	5	1	2	4	3	5	5
1-104	320	5	5	5	4	1	1	2	4	4	5	5	3	4	0	3	4	2	4	4

Tabla 69

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-105	320	4	1	4	1	1	1	1	3	3	5	4	1	3	0	1	2	1	4	3
1-106	320	5	5	5	4	1	3	3	4	5	5	5	4	5	3	1	3	3	5	4
1-107	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	1	5	3	5	5
1-108	320	5	5	5	2	1	2	2	4	5	5	5	3	5	1	1	4	1	5	3
1-109	320	4	3	5	1	0	0	0	4	4	5	4	2	4	0	1	3	0	4	4
1-110	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	4	4	3	5	5
1-112	320	1	0	2	0	0	0	0	3	4	5	4	0	5	0	0	3	0	5	3
1-113	320	1	0	2	0	0	0	0	1	3	5	4	0	3	0	0	0	0	3	0
1-114	320	1	0	3	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	0	0	4	0
1-115	320	5	5	5	2	2	1	2	3	4	5	4	3	4	0	0	2	2	5	1
1-116	320	5	4	5	3	1	1	1	4	4	5	5	3	4	0	0	3	2	5	4
1-117	320	1	1	4	0	0	0	0	3	3	5	3	1	3	0	0	3	0	3	1
1-118	320	5	5	5	3	1	1	3	4	4	5	4	4	5	4	0	4	1	5	5
1-119	320	5	4	5	3	3	2	3	5	5	5	4	4	5	3	2	4	3	5	5
1-120	320	5	5	5	3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	2	0	4	3	5	5
1-121	320	5	4	5	3	3	3	3	4	5	5	5	3	5	2	2	4	3	5	5
1-122	320	5	5	5	2	3	3	4	5	5	5	5	4	5		2	5	2	5	5
1-123	320	4	3	4	1	0	0	0	4	4	5	4	2	3		0	3	0	4	3
1-124	320	5	3	5	2	0	0	1	5	4	5	3	2	2		1	3	0	3	0
1-125	320	4	1	4	1	0	0	0	3	3	5	4	0	0		2	3	1	5	3
1-126	320	4	3	5	0	0	0	1	3	3	5	5	1	4		1	2	0	5	3
1-127	320	1	1	4	0	0	0	0	2	1	5	3	0	1		0	1	0	2	0
1-128	288	5	2	5	0	1	1	1	3	3	5	5	1	5		0	3	1	5	3
1-129	320	4	4	5	2	1	1	1	3	4	5	5	0			2	4	1	5	3
1-130	320	4	4	5	1	1	1	1	3	3	5	3	4	3		0	3	0	5	4
1-131	320	4	3	4	0	0	0	0	3	3	5	3	0	3		0	3	0	3	0
1-132	320	4	3	5	1	1	1	2	4	3	5		2	4		2	3	1	5	4
1-133	320	3	0	4	0	0	0	0	3	3	4	4	1	2		0	3	0	3	0
1-134	320	4	3	5	0	1	1	1	4	3	5	4	3	4		0	3	1	5	4
1-135	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	0	1		0	3	0	4	0
1-136	320	4	2	4	0	0	0	1	3	2	5	4	0	3		1	3	0	4	0
1-137	320	4	5	5	3	2	2	4	3	4	5	5	3	5		0	4	2	5	5
1-138	320	4	3	5	2	1	1	3	3	4	5	5	2	5		0	3	1	5	4

ES 2 651 491 T3

1-139	320	5	3	5	1	0	1	0	3	4	5	5	2	5	0	3	1	5	4	
1-141	320	3	1	4	0	0	0	0	3	3	4	3	1	3	0	1	0	4	4	
1-142	320	1	0	3	0	0	0	0	0	1	4	2	1	0	0	0	0	3	0	
1-143	320	2	0	4	0	0	0	0	2	2	4	3	2	3	0	1	0	2	3	
1-144	320	3	2	5	2	1	1	0	2	4	5	5	3	4	0	0	4	1	5	4
1-145	320	5	4	5	3	1	2	3	3	4	5	5	1	5	3	0	3	2	5	3
1-146	320	5	5	5	4	2	4	4	4	5	5	5	5	5	5	0	5	3	5	5
1-147	320	4	3	4	3	2	3	3	3	4	5	5	3	5	0	0	3	3	5	5
1-148	320	4	3	5	1	1	3	2	3	5	5	5	4	5	3	0	3	0	5	4
1-149	320	4	3	4	1	1	1	2	3	3	5	5	3	5	1	0	3	0	5	5
1-150	320	4	3	5	3	1	3	3	3	5	5	5	4	5	3	0	4	3	5	5
1-151	320	5	3	5	3	1	3	2	3	5	5	5	4	5	0	0	4	3	5	5
1-152	320	4	3	4	2	0	1	1	3	4	5	4	1	3	0	0	3	0	4	1
1-153	320	4	4	5	3	1	1	2	3	4	5	5	4	4	3	0	5	2	5	3

Tabla 70

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-154	320	3	2	3	0	0	0	0	2	2	5	4	0	0	0	0	2	0	4	0
1-155	320	3	1	3	0	0	0	0	3	3	5	0	2	0	0	0	3	0	5	0
1-156	320	2	1	4	1	1	1	2	3	3	5	4	1	3	0	0	3	1	3	0
1-157	320	3	1	3	1	1	1	1	3	3	5	1	2	0	0	3	1	4	2	
1-158	320	5	4	5	3	1	2	3	4	4	5	5	3	4	0	0	4	2	5	3
1-159	320	4	4	5	2	1	2	2	3	3	5	5	2	3	0	0	3	1	4	1
1-160	320	1	0	2	0	0	0	0	3	1	4	3	0	1	0	0	2	0	2	0
1-161	320	3	0	3	0	0	0	0	1	0	4	0	0	1	0	0	1	0	1	0
1-162	320	3	1	4	1	1	1	0	3	4	4	3	2	3	0	0	3	0	3	1
1-163	320	4	3	5	2	1	1	1	4	4	5	4	3	2	0	0	4	1	4	3
1-164	320	5	5	5	3	1	1	3	4	5	5	4	4	4	0	5	3	5	4	
1-165	320	3	1	4	0	0	0	2	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	5	4
1-166	320	5	4	5	1	0	1	1	3	4	5	4	1	0	0	4	0	5	4	
1-167	320	0	0	2	1	0	1	1	2	2	5	5	2	4	0	0	1	0	5	0
1-168	320	5	4	5	1	0	1	0	3	3	5	5	1	5	3	0	3	1	5	3
1-169	320	4	3	5	1	1	1	1	3	5	5	1	4	0	1	5	1	5	0	
1-170	320	4	3	4	1	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	0	2	0	5	3
1-171	320	3	3	5	0	0	0	1	4	4	5	5	2	3	0	0	3	0	5	3
1-172	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-173	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-174	320	0	0	0	0	0	0	0	0	4	5	3	3	3	0	0	0	0	4	0
2-001	320	3	0	4	1	0	1	0	5	5	5	5	4	5	0	0	2	0	5	4
2-002	320	4	3	5	3	1	1	1	5	5	5	5	4	5	2	0	3	1	5	4
2-003	320	5	5	5	3	3	3	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	3	5	5
2-005	320	5	4	5	3	3	2	4	5	5	5	5	4	5	0	1	3	3	5	4
2-006	320	5	5	5	3	2	1	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	3	5	4
2-007	320	5	4	5	3	2	2	4	5	5	5	5	1	5	2	0	3	2	5	4
2-008	320	3	2	4	3	1	2	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	2	5	3
2-009	320	4	3	5	3	1	2	1	5	5	5	5	4	4	2	1	4	1	5	4
2-010	320	4	3	5	4	3	3	2	5	5	5	5	4	5	5	3	4	3	5	5
2-011	320	5	3	5	3	3	2	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	1	5	1
2-012	320	4	1	4	3	2	2	2	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-013	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-014	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	4
2-015	320	5	4	5	2	2	2	2	5	5	5	4	3	3	4	2	2	2	4	3
2-016	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	4	5	4
2-017	320	5	5	5	4	3	2	4	5	5	5	5	1	5	5	1	4	3	5	4
2-018	320	2	1	1	0	0	0	0	3	3	0	1	2	0	0	0	0	1	0	
2-019	320	5	5	5	3	2	2	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	4
2-020	320	3	3	3	1	0	1	1	5	4	5	4	2	4	2	0	3	1	5	3
2-021	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	4	3	5	4
2-022	320	4	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	4	5	5	1	5	3	5	5
2-023	320	1	1	4	0	0	0	0	3	5	4	3	4	0	0	1	0	4	1	
2-024	320	5	5	5	4	3	4	5	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5	5	
2-025	320	5	5	5	4	3	0	4	5	5	5	5	4	5	5	1	4	3	5	4
2-026	320	5	4	5	3	4	3	3	5	5	5	5	4	5	5	2	5	3	5	5

ES 2 651 491 T3

2-027	320	5	5	5	3	4	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	1	3	5	4
-------	-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

Tabla 71

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-028	320	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	5
2-029	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	5	5	5
2-030	320	5	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	3	5	5	0	4	3	5	5
2-031	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5
2-034	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5
2-035	320	5	5	5	4	3	4	5	5	5	5	5	2	5	5	2	4	4	5	5
2-036	320	5	4	5	1	0	0	3	5	5	5	5	4	4	0	0	2	0	5	3
2-037	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-039	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	5
2-040	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	3
2-041	320	4	3	5	3	3	3	4	5	4	5	5	4	4	2	0	4	3	5	4
2-042	320	5	5	5	2	2	1	0	5	5	5	3	1	5	4	0	3	0	4	2
2-043	320	5	4	5	4	3	2	4	5	5	5	5	4	5	3	1	4	3	5	4
2-044	320	5	4	5	2	2	2	3	5	5	5	4	3	5	3	2	4	1	5	3
2-045	320	5	4	5	2	1	1	3	5	5	5	5	3	5	4	3	4	1	5	5
2-046	320	0	1	3	0	0	0	0	4	4	4	2	1	1	0	0	0	0	2	0
2-047	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	4	3	5	3	0	3	3	5	3
2-048	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	4	4	4	4	4	5	4	5	5
2-049	320	5	5	5	3	1	3	4	4	3	5	3	5	3	4	2	1	4	0	3
2-050	192	3	1	3	2	0	0	0	3	2	5	3	0	3	0	0	3	0	3	0
2-051	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	4	4	5	4
2-052	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5
2-055	131	0	0	0	0	0	0	0	4	3	5	4	0	0	0	1	0	1	0	0
2-056	320	5	3	4	1	1	1	1	4	4	5	5	4	5	4	0	1	3	1	5
2-057	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	4	5	5
2-058	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5	5
2-060	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	2	4	4	5	5
2-061	320	5	5	5	4	3	4	3	4	5	5	5	3	5	5	3	4	3	5	4
2-062	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5
2-063	320	5	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	4
2-064	320	3	2	3	0	0	0	0	5	5	5	5	1	5	0	0	3	0	4	3
2-065	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	3	4	4	3	5	4
2-066	320	5	5	5	2	3	3	3	4	5	5	5	3	5	4	1	4	3	5	4
2-067	320	5	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	4	5	5	4	5	4	5	5
2-068	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	5	3	4	2	5	4
2-069	320	5	5	5	5	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	3	5	5
2-070	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	5	3	4	3	4	5	5
2-071	320	5	4	5	2	1	1	1	4	5	5	5	3	5	1	2	3	1	5	4
2-072	320	5	5	5	1	1	1	3	5	5	5	5	3	5	1	3	4	1	5	4
2-073	320	1	1	4	1	0	1	0	3	3	5	4	0	2	0	0	2	0	3	0
2-074	320	5	4	5	4	3	3	3	4	5	5	4	3	5	5	3	4	3	5	4

5 Tabla 72

N.º	Cantidad de aplicación de herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-075	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	5	4	5	5
2-076	320	3	3	5	1	1	1	2	4	5	5	5	3	5	1	0	1	0	5	4
2-077	320	4	2	4	0	0	0	0	4	5	5	4	3	3	0	0	2	0	5	2
2-078	320	5	5	5	3	4	4	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	5
2-079	320	5	5	5	3	4	2	5	5	5	5	5	4	5	5	2	4	2	5	5

2-080	320	5	3	5	1	1	0	3	5	5	5	4	4	5	3	0	4	0	5	5
2-081	320	4	3	5	3	1	1	1	4	5	5	5	3	4		0	3	2	5	4
2-082	320	5	5	5	2	4	4	4	5	5	5	5	4	4		1	5	4	5	5
2-083	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4		0	4	0	5	1
2-084	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	3		1	3	3	5	3
2-085	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4		2	5	3	5	4
2-086	320	5	5	5	3	1	2	4	5	5	5	4	4	5		0	4	2	5	3
2-087	320	5	4	5	4	3	3	4	5	4	5	5	3			0	3	2	5	3
2-088	141	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	4		0	4	0	5	5
2-089	320	4	4	4	1	2	1	4	4	4	5	5	3	5		0	4	0	5	4
2-090	320	5	4	5	4	3	4	4	3	4		5	4	3	3	1	3	3	5	4
2-091	320	5	5	5	3	2	3	3	4	4	5	5	4	4	2	0	3	3	5	5
2-092	320	0	0	2	1	0	0	0	1	1	3	3	1	1	0	0	1	0	3	0
2-093	320	1	0	1	1	1	1	1	3	2	5	5	2	2	0	0	3	1	2	1
2-094	320	4	4	5	2	1	1	3	5	4	5	5	3	4	3	1	4	1	5	4
2-095	320	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5	3	5	5
2-096	320	5	4	5	1	0	0	0	5	5	5	4	3	3	0	0	3	0	5	0
2-097	320	4	3	5	2	1	1	2	3	3	5	4	3	4	0	0	3	0	4	1
2-098	320	5	5	5	4	2	3	4	4	5	5	5	4	4	4	1	4	3	5	4
2-099	320	5	4	5	2	0	1	1	4	4	5	5	4	5	3	0	4	0	5	4
2-100	320	5	4	5	3	2	3	4	5	5	5	5	5	5	5	0	4	0	5	5
2-101	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	3	5	5
2-102	320	5	4	5	1	0	1	3	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	3
2-103	320	4	3	5	1	0	1	2	4	5	5	5	4	4	2	0	4	0	5	3
2-105	320	5	4	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	5
2-106	320	3	1	3	1	0	0	0	5	4	5	4	3	3	0	0	4	0	5	3
2-107	320	5	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	3	0	5	0	5	4
2-108	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	4	0	4	1	5	5
2-109	256	3	2	4	1	0	1	0	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	4
2-110	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	4	3	5	4
3-002	320	0	0	0	0	0	0	0	1	3	4	1	0	0	0	0	0	0	0	0
4-001	320	1	2	3	1	0	0	0	5	5	5	3	3	3	0	0	2	0	2	0
4-002	320	1	1	2	1	0	0	0	5	4	4	3	1	1	0	0	1	0	0	0
4-003	320	2	1	4	0	0	0	1	4	2	5	4	1	2	0	0	4	0	4	1
4-004	320	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
6-001	320	1	2	1	0	0	0	0	3	3	4	4	2	2	0	0	0	0	3	0
6-002	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	3	4	0	0	3	0	3	3
6-003	320	4	3	3	0	0	0	0	4	2	3	4	1	1	0	0	0	0	1	0
6-004	320	5	4	5	3	1	2	1	5	5	5	4	4	3	0	0	4	1	2	3
6-005	320	3	1	3	0	1	1	1	4	3	3	1	1	1	0	0	0	0	1	0
6-006	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	1	0	0	0	0	0	0
6-007	320	0	0	0	0	0	0	0	2	3	3	0	0	0	0	0	2	0	3	0

Tabla 73

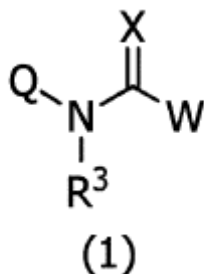
N.º	Cantidad de aplicación de herbicida(g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
6-008	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	0	0	0	1	0	1	0
7-001	320	0	0	1	0	0	0	0	1	0	2	1	0	0	0	0	0	0	0	0
7-002	320	3	2	4	1	0	0	0	3	4	5	4	3	3	0	0	2	0	4	3

5 **Aplicabilidad industrial**

El compuesto de amida heterocíclico de la presente invención es un compuesto novedoso y es útil como herbicida selectivo para *Oryza sativa*, *Zea mays*, *Glycine max*, *Triticum aestivum*, *Beta vulgaris ssp. vulgaris* y *Brassica campestris L.*

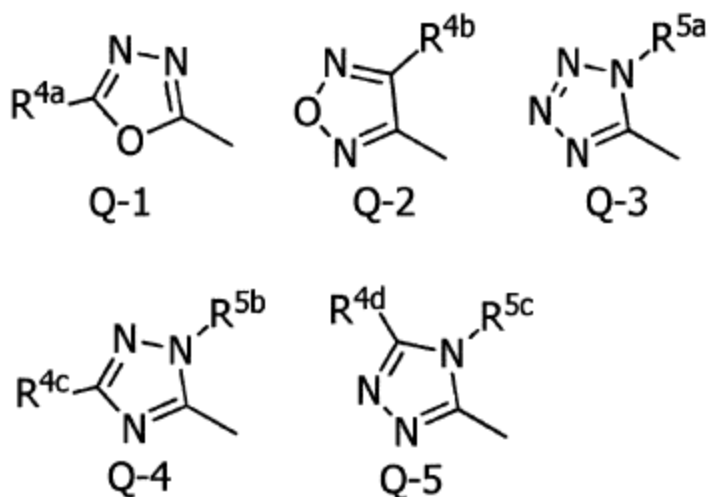
REIVINDICACIONES

1. Compuesto de amida heterocíclico de fórmula (1):



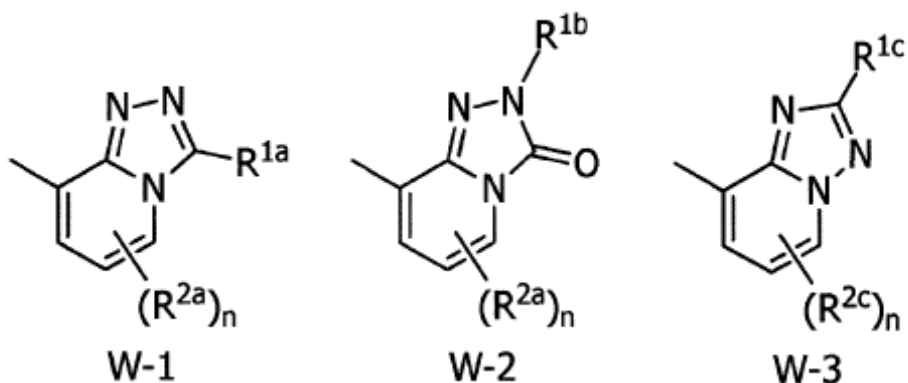
5

[en donde Q es un heterociclo aromático de uno cualquiera de Q-1 a Q-5;



10

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;



15

X es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

20

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, -C(O)R⁸, -C(O)OR¹⁶, ciano, -OR⁹, -S(O)_{m1}R¹⁰, -N(R¹¹)R¹², -C(=NR^{12b})R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, naftilo o un grupo cualquiera de U-1 a U-25;

R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, fenilo, fenilo sustituido con

$(R^7)_p$, naftilo, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

5 R^{1c} es alquilo C_{1-6} ;

10 R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{24}$, ciano, nitro, $-OR^{19}$, $-S(O)_mR^{20}$, $-N(R^{21})R^{22}$, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{2a} son adyacentes, los dos R^{2a} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono unidos a cada R^{2a} formando $-CH=CH-CH=CH-$;

R^{2c} es haloalquilo C_{1-6} ;

15 R^3 es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , $-C(O)R^{25}$ o $-C(O)OR^{26}$;

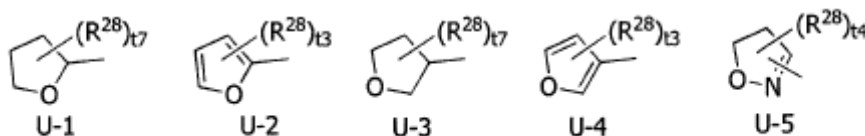
20 R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , $-NH_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, $-NHC(O)R^8$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

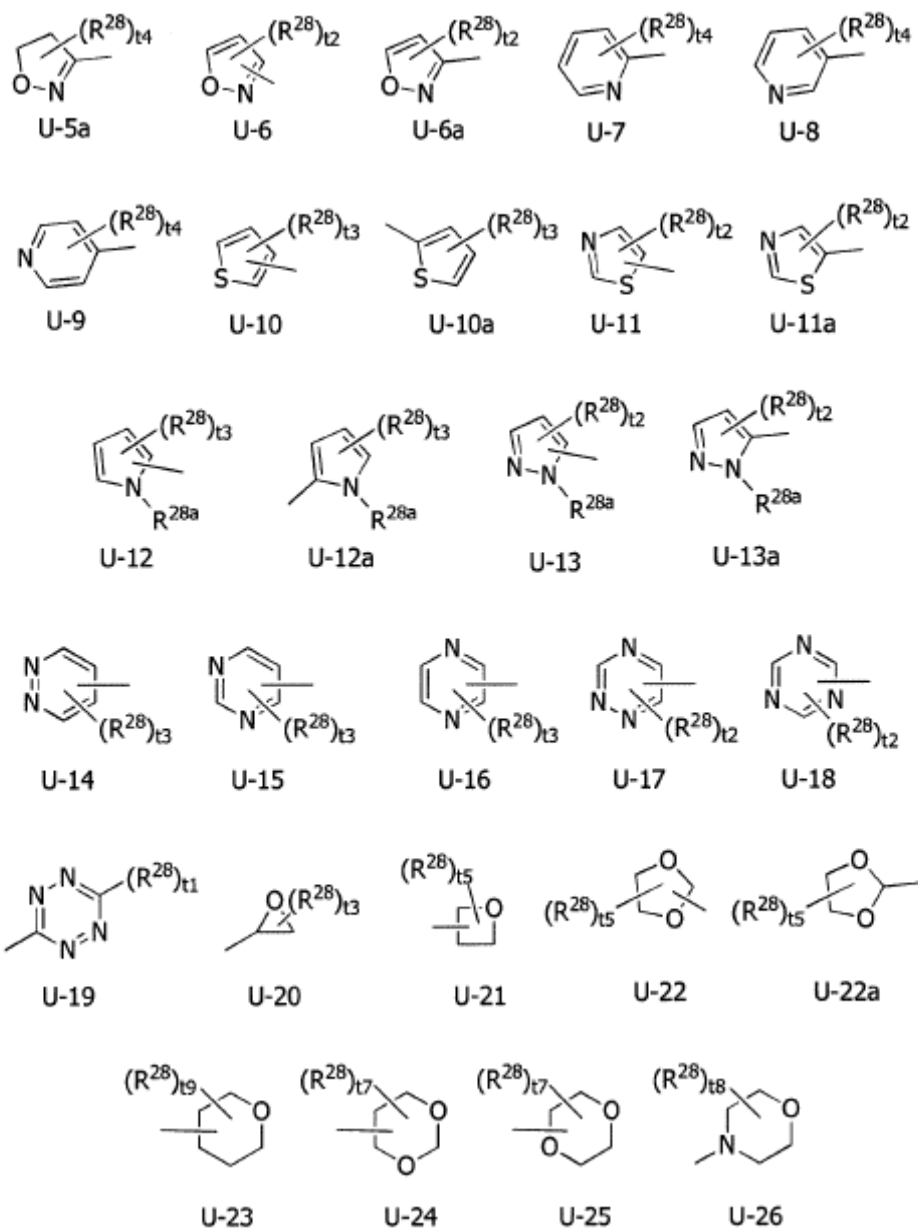
25 R^{4b} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{38}$, $-S(O)_mR^{20}$, $-NH_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, $-NHC(O)R^8$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

30 R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{4d} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{35} ;

40 U-1 a U-6, U-6a, U-7 a U-10, U-10a, U-11, U-11a, U-12, U-12a, U-13, U-13a, U-14 a U-22, U-22a, U-23, U-24, U-25 y U-26 son heterociclos respectivos de las siguientes estructuras;





5 R^{5a} y R^{5b} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquino C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , fenilo o fenilo sustituido con (R^{28})_i;

10 R^{5c} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{36} , o R^{5c} forma opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} está unido formando $-(CH_2)_4-$ o $-CH=CH-CH=CH-$ con R^{4d} ;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{13}$, $-S(O)_{m2}R^{14}$, fenilo o fenilo sustituido con (R^7)_p;

15 R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , haloalqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquino C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , alquilcarbonilo C_{1-6} , cicloalquilcarbonilo C_{3-6} , haloalquilcarbonilo C_{1-6} , halocicloalquilcarbonilo C_{3-6} , alcóxicarbonilo C_{1-6} , haloalcoxycarbonilo C_{1-6} , alquilaminocarbonilo C_{1-6} , haloalquilaminocarbonilo C_{1-6} , di(alquilamino C_{1-6})carbonilo, $-OR^{15}$, $-S(O)_{m3}R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})aminosulfonilo, $-NH_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclo de 3-7 miembros o heterociclo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

20

R⁸ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o -N(R^{11a})R^{12a};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R⁹ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo;

R¹⁰ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ o haloalquinilo C₂₋₆;

R¹¹ y R¹² son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19, o R¹¹ forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R¹¹ y R¹² están unidos formando una cadena de alquileo C₂₋₆ junto con R¹², y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R³³) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{11a} y R^{12a} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo, o R^{11a} forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquileo C₂₋₆ junto con R^{12a}, y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R³³) y está opcionalmente sustituida con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{12b} es -OR^{19b};

R¹³ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, -C(O)R⁸ o fenilo;

R¹⁴ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆ o fenilo;

R¹⁵ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆ o cicloalquenilo C₃₋₆;

R¹⁶ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁷;

R¹⁸ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R¹⁹ es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo;

R^{19b} es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R²⁰ es alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆ o cicloalquenilo C₃₋₆;

R²¹ y R²² son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo, o R²¹ forma opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R²¹ y R²² están unidos formando una cadena de alquileo C₂₋₆ junto con R²², y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O), S(O)₂ o N(R³⁹) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R²⁴ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R²⁵ y R²⁶ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆ o fenilo;

R²⁷ es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con (R²⁸)_r, -C(O)OR¹⁶, -OR²⁹, -S(O)_mR³⁰, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R²⁸ y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R²⁸ y R^{28a});

R²⁸ es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, halocicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, haloalquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquinilo C₂₋₆, (alcoxi C₁₋₆)-alquilo C₁₋₆, -OR³¹ o -S(O)_mR³⁰; cuando t2, t3, t4, t5, t7, t8 o t9 es un número entero de 2 o más, R²⁸ son opcionalmente iguales o diferentes entre sí; además cuando dos R²⁸ son adyacentes, los dos R²⁸ adyacentes forman

opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$;

R^{28a} es alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , (alcoxi C_{1-6})-alquilo C_{1-6} o (alquiltio C_{1-6})-alquilo C_{1-6} ;

R^{29} , R^{30} y R^{31} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{33} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$, $-\text{OR}^{33}$, $-\text{S}(\text{O})_{m6}\text{R}^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(\text{R}^7)_p$, U-1, U-3, U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-25;

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6} ;

R^{36} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6} ;

R^{37} es alcoxilo C_{1-6} .

R^{38} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{39} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

t1 es un número entero de 0 o 1;

m1, m2, m3, m4, m6 y t2 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1 ó 2;

n y t3 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1, 2 ó 3;

p y r son cada uno independientemente un número entero de 1, 2, 3, 4 ó 5;

t4 es un número entero de 0, 1, 2, 3 ó 4;

t5 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

t7 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6 ó 7;

t8 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; y

t9 es un número entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 ó 9] o una sal del mismo.

2. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 1, en el que W es un heterociclo aromático de W-1 o W-2; y

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{24}$, ciano, nitro, $-\text{OR}^{19}$ o $-\text{S}(\text{O})_{m3}\text{R}^{20}$, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí.

3. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 2, en el que R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , fenilo, fenilo sustituido con $(\text{R}^7)_p$, naftilo o un grupo cualquiera de U-1 a U-25;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , $-\text{NH}_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino, $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^8$, fenilo, fenilo sustituido con $(\text{R}^{28})_r$, o un grupo cualquiera de U-1 a U-26;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , alquilcarbonilo C_{1-6} , cicloalquilcarbonilo C_{3-6} , haloalquilcarbonilo C_{1-6} , halocicloalquilcarbonilo C_{3-6} , alcoxycarbonilo C_{1-6} , haloalcoxycarbonilo C_{1-6} , alquilaminocarbonilo C_{1-6} , haloalquilaminocarbonilo C_{1-6} , di(alquilo C_{1-6} amino)carbonilo, $-\text{OR}^{15}$, $-\text{S}(\text{O})_{m3}\text{R}^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})aminosulfonilo, $-\text{NH}_2$, alquilamino C_{1-6} , di(alquil C_{1-6})amino o un grupo cualquiera de U-1 a U-

26; y

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{29}$, $-S(O)_{m4}R^{30}$, o un grupo cualquiera de U-1 a U-26.

- 5
4. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 3, en el que R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6 , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , $-C(O)R^8$, $-OR^9$, $-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, $-C(=NR^{12b})R^{8b}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{1b} es alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^6 ;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} o $-S(O)_{m3}R^{20}$, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^3 es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , cicloalquilo C_{3-6} , fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$ o un heterociclo de U-1, U-2, U-7, U-10a o U-26;

R^{4b} es alquilo C_{1-6} ;

R^{4c} es un átomo de hidrógeno;

R^{4d} es alquilo C_{1-6} ;

R^{5a} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} , alquenilo C_{2-6} , o fenilo;

R^{5b} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

R^{5c} es alquilo C_{1-6} , o R^{5c} forma opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} está unido formando $-(CH_2)_4-$ o $-CH=CH-CH=CH-$ con R^{4d} ;

R^7 es un átomo de halógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} u $-OR^{15}$;

R^{8b} es un átomo de hidrógeno;

R^9 es alquilo C_{1-6} ;

R^{10} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6} ;

R^{11} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

R^{11} forma opcionalmente un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileo C_{4-5} junto con R^{12} , y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O) o S(O)₂;

R^{11a} es alquilo C_{1-6} ;

R^{12a} es un átomo de hidrógeno;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} , $-C(O)R^8$ o fenilo;

R^{14} es alquilo C_{1-6} o alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34} ;

R^{15} es alquilo C_{1-6} ;

R^{19b} es alquilo C_{1-6} ;

R²⁰ es alquilo C₁₋₆;

R²⁷ es un átomo de halógeno, fenilo, fenilo sustituido con (R²⁸)_r, -OR²⁹, -C(O)OR¹⁶ o -S(O)_{m4}R³⁰;

5 R²⁸ es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆ u -OR³¹; cuando t2, t3, t4, t5 o t7 es un número entero de 2 o más, R²⁸ son opcionalmente iguales o diferentes entre sí; y además cuando dos R²⁸ son adyacentes, los dos R²⁸ adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R²⁸ está unido formando -CH=CH-CH=CH-;

10 R²⁹ es alquilo C₁₋₆;

R³⁰ es alquilo C₁₋₆;

15 R³¹ es alquilo C₁₋₆;

R³³ es alquilo C₁₋₆; y

20 R³⁴ es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -C(O)R⁸, -C(O)OR¹⁶, -OR³³, -S(O)_{m6}R³³, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-1, U-8 o U-22a.

5. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 4, en el que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

25 6. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 5, en el que X es un átomo de oxígeno;

30 R^{1a} un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, -C(O)R⁸, -OR⁹, -S(O)_{m1}R¹⁰, -N(R¹¹)R¹², -C(=NR^{12b})R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

35 R^{2a} es un alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆ o -S(O)_{m3}R²⁰, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R⁶ es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C₃₋₆, -C(O)R⁸, -C(O)OR¹⁶, -OR¹³, -S(O)_{m2}R¹⁴ o fenilo sustituido con (R⁷)_p; y

40 R²⁷ es un átomo de halógeno, fenilo, -OR²⁹ o -S(O)_{m4}R³⁰.

7. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 6, en el que R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R²⁷ o cicloalquilo C₃₋₆; y

45 R²⁷ es un átomo de halógeno u -OR²⁹.

8. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 4, en el que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

50 W es un heterociclo aromático de W-1.

9. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 8, en el que R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo (C₃₋₆) opcionalmente sustituido con R⁶, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, -C(O)R⁸, -S(O)_{m1}R¹⁰, -N(R¹¹)R¹², fenilo, fenilo sustituido con (R⁷)_p, U-3, U-5a, U-6a, U-8, U-10a o U-13a;

55 R^{2a} es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆, y cuando n es un número entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

60 R⁶ es un átomo de halógeno, -C(O)OR¹⁶, -OR¹³, -S(O)_{m2}R¹⁴ o fenilo sustituido con (R⁷)_p;

R⁷ es un átomo de halógeno, alquilo C₁₋₆ u -OR¹⁵;

R⁸ es un átomo de hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

65 R¹¹ es alquilo C₁₋₆, alquilo (C₁₋₆) opcionalmente sustituido con R³⁴, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, alquino

C_{2-6} , fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^{11} forma opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileo C_5 junto con R^{12} , y en este caso, la cadena de alquileo contiene opcionalmente un O, S, S(O) o S(O)₂;

R^{16} es un átomo de hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

R^{27} es fenilo sustituido con $(R^{28})_f$, $-OR^{29}$, $-C(O)OR^{16}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno o alquilo C_{1-6} ; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6} , $-OR^{33}$, $-S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 o U-8.

10. Compuesto de amida heterocíclico o sal del mismo según la reivindicación 9, en el que R^{5a} es alquilo C_{1-6} , alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27} o alquileo C_{2-6} ; y

R^{27} es $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$.

11. Producto químico agrícola que comprende uno o dos o más de compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclico y la sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1 ó 2 como componente activo.

12. Herbicida que comprende uno o dos o más de compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclico y la sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1 ó 2 como componente activo.